

【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)
 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)
 A 61 K 9/10(2006.01)
 A 61 P 1/04(2006.01)
 A 61 P 29/00(2006.01)

10

20

30

40

【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
 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】

【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】

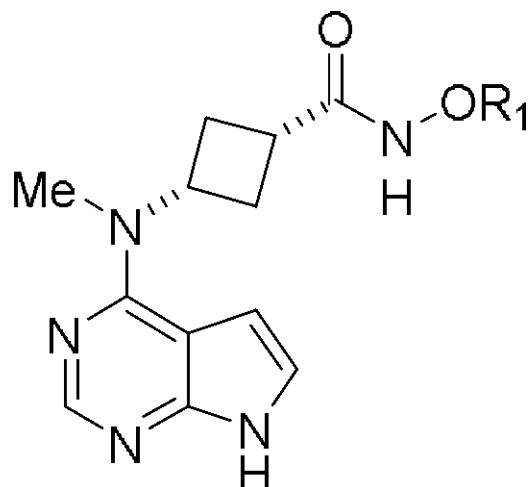
【特許請求の範囲】

【請求項1】

構造：

50

【化 1】



10

[式中、R₁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、(C₁～C₆)アルキル、(C₃～C₁₀)シクロアルキルから選択され、それは、ハロ、(C₁～C₃)アルキル、および(C₁～C₃)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】

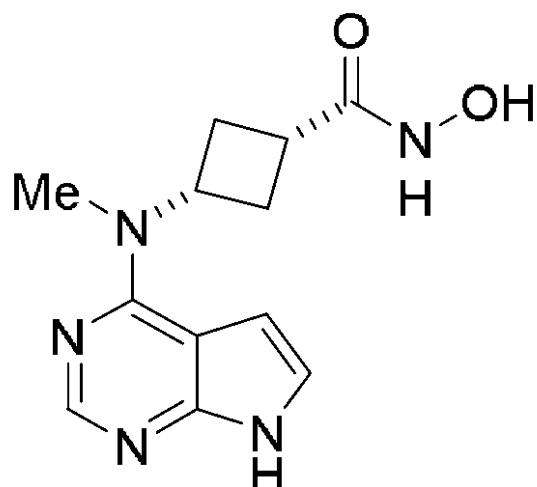
R₁が水素である、請求項1に記載の化合物、またはその塩。

30

【請求項 3】

構造：

【化 2】



40

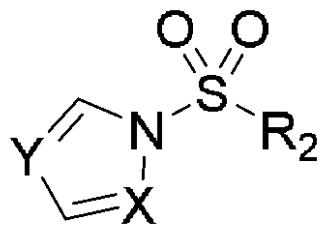
を有する化合物、(1s, 3s)-N-ヒドロキシ-3-(メチル(7H-ピロロ[2,3-d]ピリミジン-4-イル)アミノ)シクロブタン-1-カルボキサミドまたはその塩。

50

【請求項 4】

構造：

【化3】



[式中、R₂は、(C₃～C₅)アルキルおよび(C₃～C₄)シクロアルキルから選択され、

10

XおよびYは、CR₃およびNから独立して選択され、式中、R₃は、水素、および(C₁～C₆)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、R₂が(C₃～C₅)アルキルである、請求項4に記載の化合物。

20

【請求項6】

R₂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】

R₂が直鎖状プロピル基である、請求項4に記載の化合物。

20

【請求項8】

XがCR₃であり、式中、R₃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】

R₂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】

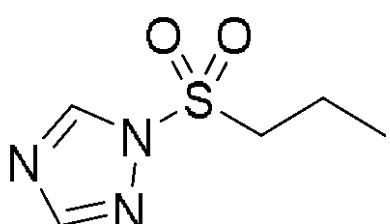
R₂が直鎖状プロピル基である、請求項8に記載の化合物。

【請求項11】

構造：

【化4】

30



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。

40

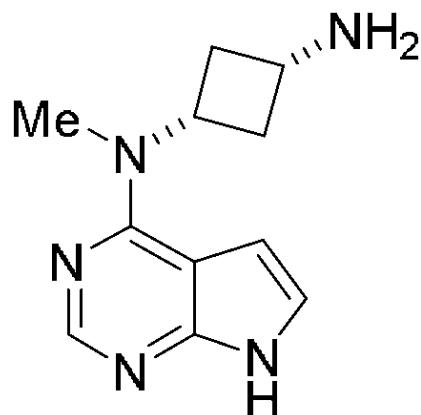
【請求項12】

構造：

40

50

【化5】



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、シユウ酸塩、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、メシリ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

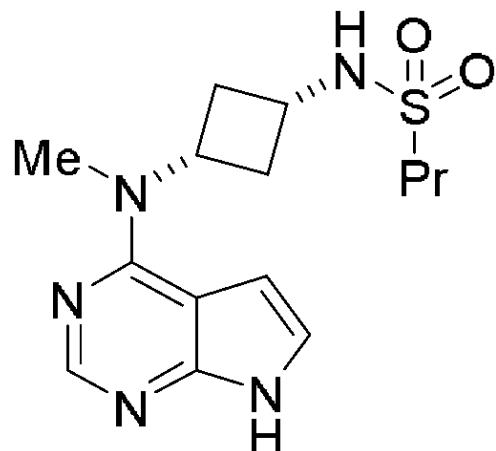
【請求項13】

請求項12に記載のリン酸塩。

【請求項14】

構造：

【化6】



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、メシリ酸塩、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。

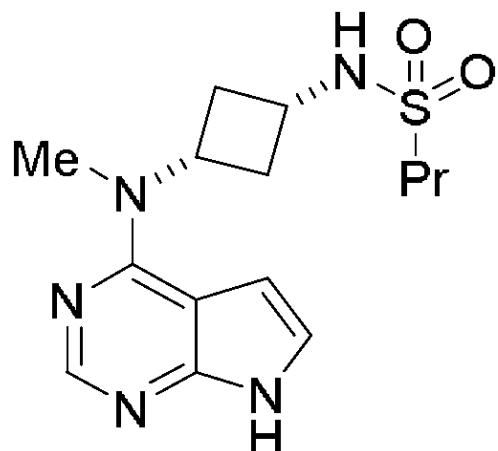
40

【請求項15】

構造：

50

【化7】



10

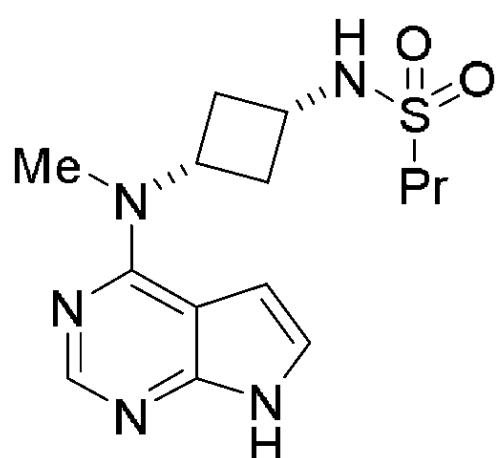
を有する化合物の酸性塩であって、前記酸性塩が塩酸塩である、化合物の酸性塩。

【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】

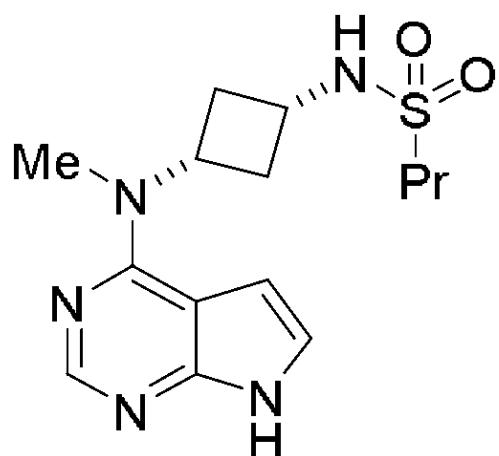
2 に関して、13.0°、14.8°および23.3° 2 ± 0.2°でのピーク 40
を含む粉末X線回折パターンを有する、請求項16に記載の化合物。

【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

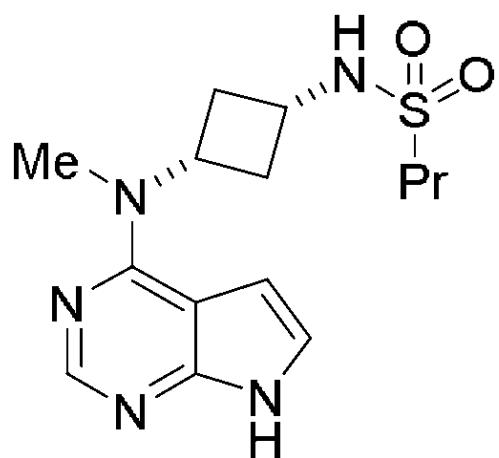
【請求項20】

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】



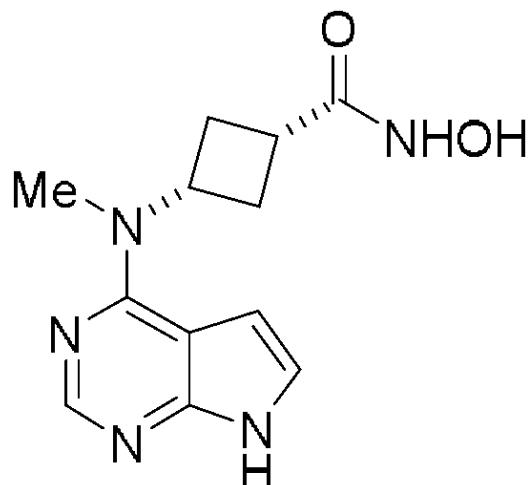
30

を有する化合物を調製するための方法であって、(a) 構造：

40

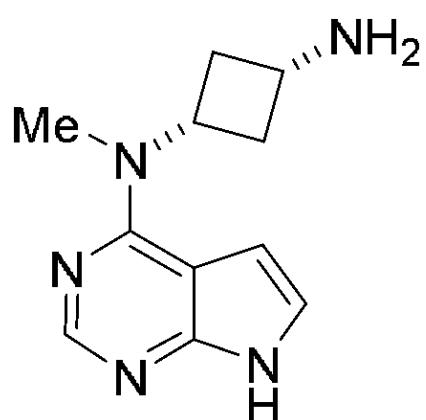
50

【化 1 1】



を有するヒドロキシリ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リルアミン化合物を反応させて、構造：

【化 1 2】

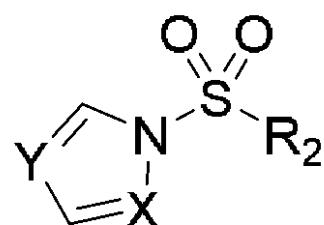


を有するアミノ化合物を調製するステップ、およびその後(c) 適当な条件下で前記アミノ化合物を適当なn-プロピルスルホン化試薬で処理して化合物を形成するステップを含む、方法。

【請求項 2 2】

n-プロピルスルホン化試薬が、構造：

【化 1 3】



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、C₁～C₆のアルキルから選択される、請求項21に記載の方法。

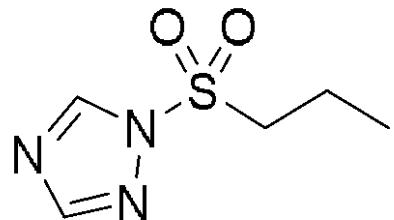
【請求項 2 3】

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】



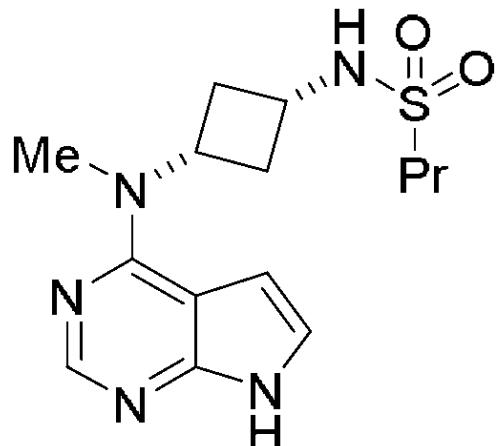
10

を有する化合物、1 - (プロピルスルホニル) - 1 H - 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 ± 0 . 2 ° 2 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 1 に記載の方法。

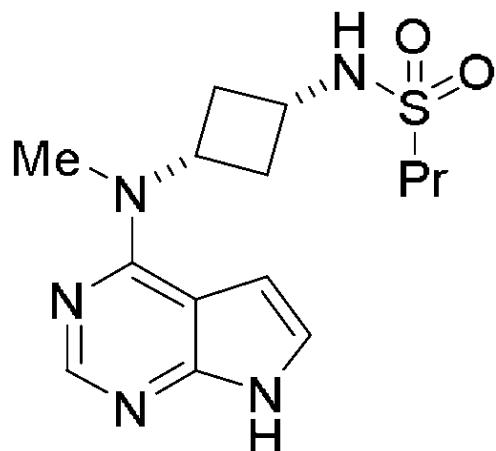
【請求項 2 6】

構造：

40

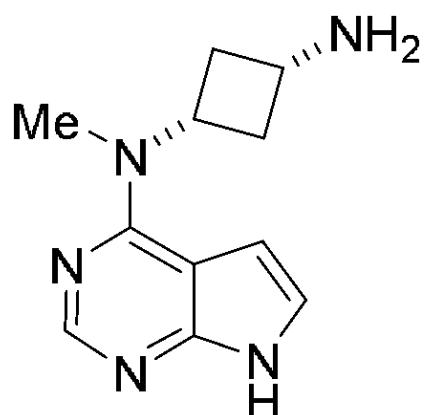
50

【化16】



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17】

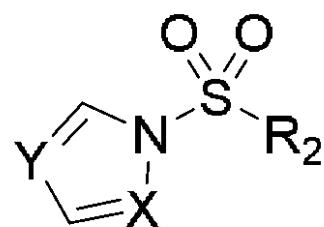


を有するアミノ化合物を調製するステップ、およびその後(b)適当な条件下で前記アミノ化合物を適当なn-プロピルスルホン化試薬で処理して化合物を形成するステップを含む、方法。

【請求項27】

n-プロピルスルホン化試薬が、構造：

【化18】



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CR3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26に記載の方法。

【請求項28】

XおよびYが両方ともNである、請求項26に記載の方法。

【請求項29】

10

20

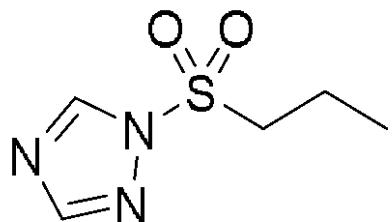
30

40

50

n - プロピルスルホン化試薬が、構造：

【化 19】



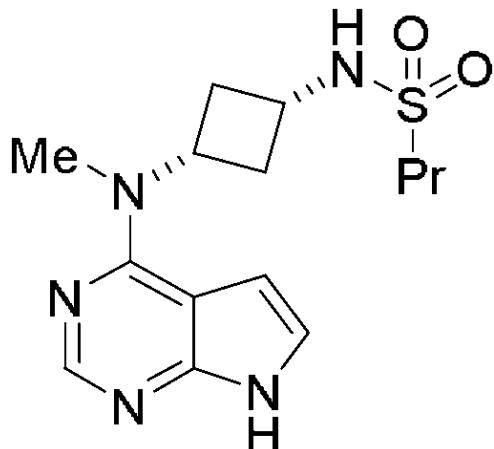
10

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 26 に記載の方法。

【請求項 30】

構造：

【化 20】



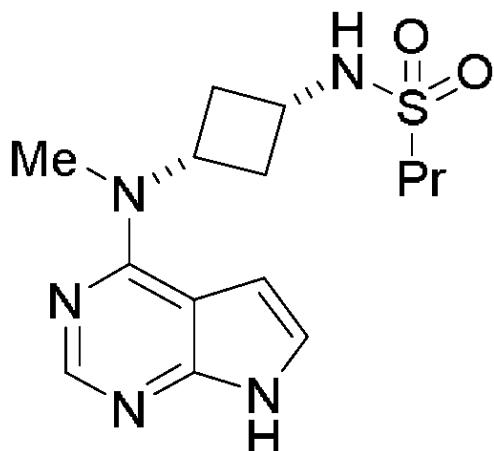
20

を有する化合物が、2 に関して、13 . 0 ° 、14 . 8 ° および 23 . 3 ° 2 ± 0 . 30
2 ° 2 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 29 に記載の方法。

【請求項 31】

構造：

【化 21】



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° \pm 0.2°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32】

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31に記載の医薬組成物。

【請求項33】

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)シクロプロパン-1-スルホニアミドを含有する、請求項32に記載の医薬組成物。

10

【請求項34】

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31から33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35】

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31から33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