

【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】平成28年6月16日(2016.6.16)

【公表番号】特表2015-514792(P2015-514792A)

【公表日】平成27年5月21日(2015.5.21)

【年通号数】公開・登録公報2015-034

【出願番号】特願2015-507484(P2015-507484)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/4155 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 P 17/06 (2006.01)

A 6 1 P 17/04 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/4155

A 6 1 P 17/00

A 6 1 P 17/06

A 6 1 P 17/04

【手続補正書】

【提出日】平成28年4月18日(2016.4.18)

【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】

哺乳動物においてステロイド反応性皮膚病の治療に用いるための医薬組成物であって、
N－{（1 S）－2－アミノ－1－[（3－フルオロフェニル）メチル]エチル}－5－
クロロ－4－（4－クロロ－1－メチル－1 H－ピラゾール－5－イル）－2－チオフェ
ンカルボキサミドまたはその薬学的に許容可能な塩；および
N－{（1 S）－2－アミノ－1－[（3，4－ジフルオロフェニル）メチル]エチル}－5－クロロ－4－（4－
クロロ－1－メチル－1 H－ピラゾール－5－イル）－2－フランカルボキサミドまたはそ
の薬学的に許容可能な塩から選択される化合物を含んでなる、医薬組成物。

【請求項 2】

前記哺乳動物がヒトである、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 3】

N－{（1 S）－2－アミノ－1－[（3－フルオロフェニル）メチル]エチル}－5－
クロロ－4－（4－クロロ－1－メチル－1 H－ピラゾール－5－イル）－2－チオフェ
ンカルボキサミドまたはその薬学的に許容可能な塩を含む、請求項 2 に記載の
医薬組成物。

【請求項 4】

N－{（1 S）－2－アミノ－1－[（3－フルオロフェニル）メチル]エチル}－5－
クロロ－4－（4－クロロ－1－メチル－1 H－ピラゾール－5－イル）－2－チオフェ
ンカルボキサミド塩酸塩を含む、請求項 2 に記載の
医薬組成物。

【請求項 5】

N－{（1 S）－2－アミノ－1－[（3－フルオロフェニル）メチル]エチル}－5－
クロロ－4－（4－クロロ－1－メチル－1 H－ピラゾール－5－イル）－2－チオフェ
ンカルボキサミドを含む、請求項 2 に記載の
医薬組成物。

【請求項 6】

N－{（1 S）－2－アミノ－1－[（3，4－ジフルオロフェニル）メチル] エチル}－5－クロロ－4－（4－クロロ－1－メチル－1 H－ピラゾール－5－イル）－2－フランカルボキサミドまたはその薬学的に許容可能な塩を含む、請求項 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 7】

前記ステロイド反応性皮膚病が接触性皮膚炎、湿疹、小児湿疹、アトピー性皮膚炎、魚鱗癬、乾癬、乾皮症、脂漏性皮膚炎、貨幣状皮膚炎、疱疹性皮膚炎、神経皮膚炎、うっ滞性皮膚炎、慢性単純性苔癬、皮膚糸状菌疹、カンジダ症、間擦疹、疥癬、バラ色秕糠疹、扁平苔癬、毛孔性紅色秕糠疹、水疱性類天疱瘡、汗疹、急性および慢性湿疹、紅斑性狼瘡（lupus erythematosus）、光アレルギー反応、掻痒、およびそれらの組合せから選択される、請求項 1 ～ 6 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 8】

前記ステロイド反応性皮膚病が乾癬である、請求項 7 に記載の医薬組成物。

【請求項 9】

前記組成物が経口投与される、請求項 7 に記載の医薬組成物。

【請求項 10】

前記組成物が局所投与される、請求項 7 に記載の医薬組成物。

【請求項 11】

哺乳動物においてステロイド反応性皮膚病の治療に用いるための医薬組成物であって、
a) N－{（1 S）－2－アミノ－1－[（3－フルオロフェニル）メチル] エチル}－5－クロロ－4－（4－クロロ－1－メチル－1 H－ピラゾール－5－イル）－2－チオフェンカルボキサミドまたはその薬学的に許容可能な塩、および
b) ステロイド反応性皮膚病を治療するために知られている少なくとも 1 種類の付加的薬剤
を含んでなる、医薬組成物。

【請求項 12】

療法において使用するための請求項 11 に記載の医薬組成物。

【請求項 13】

N－{（1 S）－2－アミノ－1－[（3－フルオロフェニル）メチル] エチル}－5－クロロ－4－（4－クロロ－1－メチル－1 H－ピラゾール－5－イル）－2－チオフェンカルボキサミドまたはその薬学的に許容可能な塩を含んでなる、局所投与に好適な医薬組成物。

【請求項 14】

哺乳動物においてステロイド反応性皮膚病の治療に用いるための医薬組成物であって、
a) N－{（1 S）－2－アミノ－1－[（3，4－ジフルオロフェニル）メチル] エチル}－5－クロロ－4－（4－クロロ－1－メチル－1 H－ピラゾール－5－イル）－2－フランカルボキサミドまたはその薬学的に許容可能な塩；および
b) ステロイド反応性皮膚病を治療するために知られている少なくとも 1 種類の付加的薬剤
を含んでなる、医薬組成物。

【請求項 15】

療法において使用するための、請求項 14 に記載の医薬組成物。

【請求項 16】

N－{（1 S）－2－アミノ－1－[（3，4－ジフルオロフェニル）メチル] エチル}－5－クロロ－4－（4－クロロ－1－メチル－1 H－ピラゾール－5－イル）－2－フランカルボキサミドまたはその薬学的に許容可能な塩を含んでなる、局所投与に好適な医薬組成物。

【請求項 17】

N－{（1 S）－2－アミノ－1－[（3，4－ジフルオロフェニル）メチル] エチル

｝－５－クロロ－４－（４－クロロ－１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－５－イル）－２－フランカルボキサミドを含む、請求項２に記載の医薬組成物。

【請求項１８】

ステロイド反応性皮膚病の治療において使用するための薬剤の製造における、

$N-\{(1S)-2\text{-アミノ-1-}[(3\text{-フルオロフェニル})\text{メチル}]\text{エチル}\}-5\text{-クロロ-4-(4-クロロ-1-メチル-1H-ピラゾール-5-イル)-2-チオフェンカルボキサミド}$ もしくはその薬学的に許容可能な塩、または

$N-\{(1S)-2\text{-アミノ-1-}[(3, 4\text{-ジフルオロフェニル})\text{メチル}]\text{エチル}\}-5\text{-クロロ-4-(4-クロロ-1-メチル-1H-ピラゾール-5-イル)-2-フランカルボキサミド}$ もしくはその薬学的に許容可能な塩、の使用。

【手続補正２】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】００９１

【補正方法】変更

【補正の内容】

【００９１】

本発明の好ましい実施形態を上記により示すが、本発明は本明細書に開示された正確な教示に限定されるものではなく、以下の特許請求の範囲に入る全ての改変に権利が留保されると理解される。

本発明は、以下の態様を含む。

〔１〕

治療を必要とする哺乳動物においてステロイド反応性皮膚病を治療する方法であって、該哺乳動物に、 $N-\{(1S)-2\text{-アミノ-1-}[(3\text{-フルオロフェニル})\text{メチル}]\text{エチル}\}-5\text{-クロロ-4-(4-クロロ-1-メチル-1H-ピラゾール-5-イル)-2-チオフェンカルボキサミド}$ またはその薬学的に許容可能な塩；および $N-\{(1S)-2\text{-アミノ-1-}[(3, 4\text{-ジフルオロフェニル})\text{メチル}]\text{エチル}\}-5\text{-クロロ-4-(4-クロロ-1-メチル-1H-ピラゾール-5-イル)-2-フランカルボキサミド}$ またはその薬学的に許容可能な塩から選択される化合物の治療上有効な量を投与することを含んでなる、方法。

〔２〕

前記哺乳動物がヒトである、〔１〕に記載の方法。

〔３〕

投与される化合物が $N-\{(1S)-2\text{-アミノ-1-}[(3\text{-フルオロフェニル})\text{メチル}]\text{エチル}\}-5\text{-クロロ-4-(4-クロロ-1-メチル-1H-ピラゾール-5-イル)-2-チオフェンカルボキサミド}$ またはその薬学的に許容可能な塩である、〔２〕に記載の方法。

〔４〕

投与される化合物が $N-\{(1S)-2\text{-アミノ-1-}[(3\text{-フルオロフェニル})\text{メチル}]\text{エチル}\}-5\text{-クロロ-4-(4-クロロ-1-メチル-1H-ピラゾール-5-イル)-2-チオフェンカルボキサミド}$ 塩酸塩である、〔２〕に記載の方法。

〔５〕

投与される化合物が $N-\{(1S)-2\text{-アミノ-1-}[(3\text{-フルオロフェニル})\text{メチル}]\text{エチル}\}-5\text{-クロロ-4-(4-クロロ-1-メチル-1H-ピラゾール-5-イル)-2-チオフェンカルボキサミド}$ である、〔２〕に記載の方法。

〔６〕

投与される化合物が $N-\{(1S)-2\text{-アミノ-1-}[(3, 4\text{-ジフルオロフェニル})\text{メチル}]\text{エチル}\}-5\text{-クロロ-4-(4-クロロ-1-メチル-1H-ピラゾール-5-イル)-2-フランカルボキサミド}$ またはその薬学的に許容可能な塩である、〔２〕

」に記載の方法。

[7]

前記ステロイド反応性皮膚病が接触性皮膚炎、湿疹、小児湿疹、アトピー性皮膚炎、魚鱗癬、乾癬、乾皮症、脂漏性皮膚炎、貨幣状皮膚炎、疱疹性皮膚炎、神経皮膚炎、うっ滞性皮膚炎、慢性単純性苔癬、皮膚糸状菌疹、カンジダ症、間擦疹、疥癬、バラ色粧糠疹、扁平苔癬、毛孔性紅色粧糠疹、水疱性類天疱瘡、汗疹、急性および慢性湿疹、紅斑性狼瘡 (lupus erythematosus)、光アレルギー反応、掻痒、およびそれらの組合せから選択される、[1]に記載の方法。

[8]

前記ステロイド反応性皮膚病が乾癬である、[7]に記載の方法。

[9]

前記化合物が経口投与される、[7]に記載の方法。

[1 0]

前記化合物が局所投与される、[7]に記載の方法。

[1 1]

前記哺乳動物がヒトである、[7]に記載の方法。

[1 2]

治療を必要とする哺乳動物においてステロイド反応性皮膚病を治療する方法であって、該哺乳動物に治療上有効な量の、

a) $N - \{ (1S) - 2 - \text{アミノ} - 1 - [(3 - \text{フルオロフェニル}) \text{メチル}] \text{エチル} \} - 5 - \text{クロロ} - 4 - (4 - \text{クロロ} - 1 - \text{メチル} - 1H - \text{ピラゾール} - 5 - \text{イル}) - 2 - \text{チオフェンカルボキサミド}$ またはその薬学的に許容可能な塩、および

b) ステロイド反応性皮膚病を治療するために知られている少なくとも1種類の付加的薬剤

を投与することを含んでなる、方法。

[1 3]

療法において使用するための[1 2]に記載の医薬合剤。

[1 4]

ステロイド反応性皮膚病の治療に有用な薬剤の製造のための、[1 2]に記載の医薬合剤の使用。

[1 5]

ステロイド反応性皮膚病の治療において使用するための薬剤の製造における、 $N - \{ (1S) - 2 - \text{アミノ} - 1 - [(3 - \text{フルオロフェニル}) \text{メチル}] \text{エチル} \} - 5 - \text{クロロ} - 4 - (4 - \text{クロロ} - 1 - \text{メチル} - 1H - \text{ピラゾール} - 5 - \text{イル}) - 2 - \text{チオフェンカルボキサミド}$ またはその薬学的に許容可能な塩の使用。

[1 6]

$N - \{ (1S) - 2 - \text{アミノ} - 1 - [(3 - \text{フルオロフェニル}) \text{メチル}] \text{エチル} \} - 5 - \text{クロロ} - 4 - (4 - \text{クロロ} - 1 - \text{メチル} - 1H - \text{ピラゾール} - 5 - \text{イル}) - 2 - \text{チオフェンカルボキサミド}$ またはその薬学的に許容可能な塩を含んでなる、哺乳動物においてステロイド反応性皮膚病の治療において使用するための医薬組成物。

[1 7]

前記哺乳動物がヒトである、[1 0]に記載の方法。

[1 8]

$N - \{ (1S) - 2 - \text{アミノ} - 1 - [(3 - \text{フルオロフェニル}) \text{メチル}] \text{エチル} \} - 5 - \text{クロロ} - 4 - (4 - \text{クロロ} - 1 - \text{メチル} - 1H - \text{ピラゾール} - 5 - \text{イル}) - 2 - \text{チオフェンカルボキサミド}$ またはその薬学的に許容可能な塩を含んでなる、局所投与に好適な医薬組成物。

[1 9]

治療を必要とする哺乳動物においてステロイド反応性皮膚病を治療する方法であって、該哺乳動物に

a) N- { (1S) - 2-アミノ-1- [(3, 4-ジフルオロフェニル) メチル] エチル } - 5-クロロ-4- (4-クロロ-1-メチル-1H-ピラゾール-5-イル) - 2-フランカルボキサミドまたはその薬学的に許容可能な塩; および

b) ステロイド反応性皮膚病を治療するために知られている少なくとも1種類の付加的薬剤

の治療上有効な量を投与することを含んでなる、方法。

[2 0]

ステロイド反応性皮膚病の治療において有用な薬剤の製造のための、 [1] に記載の化合物の使用。

[2 1]

ステロイド反応性皮膚病の治療において使用するための薬剤の製造における、 N- { (1S) - 2-アミノ-1- [(3, 4-ジフルオロフェニル) メチル] エチル } - 5-クロロ-4- (4-クロロ-1-メチル-1H-ピラゾール-5-イル) - 2-フランカルボキサミドまたはその薬学的に許容可能な塩の使用。

[2 2]

療法において使用するための、 [1 9] に記載の医薬合剤。

[2 3]

ステロイド反応性皮膚病の治療において有用な薬剤の製造のための、 [1 9] に記載の医薬合剤の使用。

[2 4]

N- { (1S) - 2-アミノ-1- [(3, 4-ジフルオロフェニル) メチル] エチル } - 5-クロロ-4- (4-クロロ-1-メチル-1H-ピラゾール-5-イル) - 2-フランカルボキサミドまたはその薬学的に許容可能な塩を含んでなる、局所投与に好適な医薬組成物。

[2 5]

投与される化合物が N- { (1S) - 2-アミノ-1- [(3, 4-ジフルオロフェニル) メチル] エチル } - 5-クロロ-4- (4-クロロ-1-メチル-1H-ピラゾール-5-イル) - 2-フランカルボキサミドである、 [2] に記載の方法。

[2 6]

N- { (1S) - 2-アミノ-1- [(3, 4-ジフルオロフェニル) メチル] エチル } - 5-クロロ-4- (4-クロロ-1-メチル-1H-ピラゾール-5-イル) - 2-フランカルボキサミドまたはその薬学的に許容可能な塩を含んでなる、哺乳動物においてステロイド反応性皮膚病の治療において使用するための医薬組成物。