

(12) 特許協力条約に基づいて公開された国際出願

訂正版

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局

(43) 国際公開日
2019年1月31日(31.01.2019)



(10) 国際公開番号

WO 2019/022235 A9

(51) 国際特許分類:

A61K 31/451 (2006.01) A61K 31/454 (2006.01)
A61K 8/49 (2006.01) A61P 17/14 (2006.01)
A61K 31/4525 (2006.01) A61Q 7/00 (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2018/028277

(22) 国際出願日: 2018年7月27日(27.07.2018)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願 2017-145442 2017年7月27日(27.07.2017) JP

(71) 出願人: 東レ株式会社 (TORAY INDUSTRIES, INC.) [JP/JP]; 〒1038666 東京都中央区日本橋室町2丁目1番1号 Tokyo (JP).

(72) 発明者: 佐々木 理恵 (SASAKI Rie); 〒2488555 神奈川県鎌倉市手広6丁目10番1号 東レ株式会社 基礎研究センター内 Kanagawa (JP). 林新之助 (HAYASHI Shinnosuke); 〒2488555 神奈川県鎌倉市手広6丁目10番1号 東レ株式会社 基礎研究センター内 Kanagawa (JP). バレット マーシャル (VALLET Martial); 〒7913193 愛媛県伊予郡松前町大字筒井1515番地 東レ株式会社 愛媛工場内 Ehime (JP). 横坂 慎也 (YOKOSAKA Shinya); 〒2488555 神奈川県鎌倉市手広6丁目10番1号 東レ株式会社 基礎研究センター内 Kanagawa (JP). 大角 和也

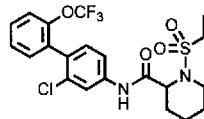
(OSUMI Kazuya); 〒2488555 神奈川県鎌倉市手広6丁目10番1号 東レ株式会社 基礎研究センター内 Kanagawa (JP). 青木 拓実 (AOKI Takumi); 〒1038666 東京都中央区日本橋室町2丁目1番1号 東レ株式会社 東京事業場内 Tokyo (JP). 目黒 裕之 (MEGURO Hiroyuki); 〒2488555 神奈川県鎌倉市手広6丁目10番1号 東レ株式会社 基礎研究センター内 Kanagawa (JP). 戒能 美枝 (KAINO Mie); 〒2488555 神奈川県鎌倉市手広6丁目10番1号 東レ株式会社 基礎研究センター内 Kanagawa (JP). 高垣 こずえ (TAKAGAKI Kozue); 〒2488555 神奈川県鎌倉市手広6丁目10番1号 東レ株式会社 基礎研究センター内 Kanagawa (JP). 高橋 雄大 (TAKAHASHI Takehiro); 〒2488555 神奈川県鎌倉市手広6丁目10番1号 東レ株式会社 基礎研究センター内 Kanagawa (JP).

(74) 代理人: 永井 浩之, 外 (NAGAI Hiroshi et al.); 〒1000005 東京都千代田区丸の内1丁目6番6号 日本生命丸の内ビル 協和特許法律事務所 Tokyo (JP).

(81) 指定国(表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DJ, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS, JO, JP, KE, KG, KH,

(54) Title: THERAPEUTIC AGENT OR PROPHYLACTIC AGENT FOR ALOPECIA AREATA

(54) 発明の名称: 円形脱毛症の治療剤又は予防剤



(57) Abstract: The purpose of the present invention is to provide a therapeutic agent or a prophylactic agent for alopecia areata, which has a ROR γ antagonistic activity. In order to achieve this purpose, a therapeutic agent or a prophylactic agent for alopecia areata is provided, which contains a cyclic amine derivative typified by the below-mentioned compound or a pharmacologically acceptable salt thereof as an active ingredient.

(57) 要約: 本発明は、ROR γ アンタゴニスト活性を有する、円形脱毛症の治療剤又は予防剤を提供することを目的とし、この目的を達成するために、下記化合物に代表される環状アミン誘導体又はその薬理的に許容される塩を有効成分として含有する、円形脱毛症の治療剤又は予防剤を提供する。

WO 2019/022235 A9

KN, KP, KR, KW, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LU, LY,
MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ,
NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT,
QA, RO, RS, RU, RW, SA, SC, SD, SE, SG, SK, SL,
SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA,
UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

- (84) 指定国(表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, ST, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, KM, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類 :

- 一 国際調査報告 (条約第21条(3))

(48) この訂正版の公開日 :

2019年4月18日(18.04.2019)

(15) 訂正情報 :

2019年4月18日(18.04.2019) の更新情報
(Notice) を参照

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2018/028277

<p>A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER Int.Cl. A61K31/451(2006.01)i, A61K8/49(2006.01)i, A61K31/4525(2006.01)i, A61K31/454(2006.01)i, A61P17/14(2006.01)i, A61Q7/00(2006.01)i</p> <p>According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC</p>														
<p>B. FIELDS SEARCHED</p> <p>Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) Int.Cl. A61K31/451, A61K8/49, A61K31/4525, A61K31/454, A61P17/14, A61Q7/00</p> <p>Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched</p> <table style="width:100%; border:none;"> <tr> <td style="width:80%;">Published examined utility model applications of Japan</td> <td style="width:20%;">1922-1996</td> </tr> <tr> <td>Published unexamined utility model applications of Japan</td> <td>1971-2018</td> </tr> <tr> <td>Registered utility model specifications of Japan</td> <td>1996-2018</td> </tr> <tr> <td>Published registered utility model applications of Japan</td> <td>1994-2018</td> </tr> </table> <p>Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used) JSTPlus/JMEDPlus/JST7580 (JDreamIII), CAplus/REGISTRY/MEDLINE/EMBASE/BIOSIS (STN)</p>			Published examined utility model applications of Japan	1922-1996	Published unexamined utility model applications of Japan	1971-2018	Registered utility model specifications of Japan	1996-2018	Published registered utility model applications of Japan	1994-2018				
Published examined utility model applications of Japan	1922-1996													
Published unexamined utility model applications of Japan	1971-2018													
Registered utility model specifications of Japan	1996-2018													
Published registered utility model applications of Japan	1994-2018													
<p>C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT</p> <table border="1" style="width:100%; border-collapse: collapse;"> <thead> <tr> <th style="width:10%;">Category*</th> <th style="width:70%;">Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages</th> <th style="width:20%;">Relevant to claim No.</th> </tr> </thead> <tbody> <tr> <td align="center">A</td> <td>WO 2015/103507 A1 (BRISTOL-MYERS SQUIBB COMPANY) 09 July 2015, entire text & JP 2017-509689 A & US 2016/0326104 A1 & EP 3092215 A1</td> <td align="center">1-5</td> </tr> <tr> <td align="center">A</td> <td>WO 2015/103508 A1 (BRISTOL-MYERS SQUIBB COMPANY) 09 July 2015, entire text & JP 2017-508782 A & US 2016/0326103 A1 & EP 3092216 A1</td> <td align="center">1-5</td> </tr> <tr> <td align="center">A</td> <td>JP 2015-514794 A (GLAXO GROUP LIMITED) 21 May 2015, entire text & US 2015/0065507 A1 & WO 2013/160419 A1 & EP 2841430 A1</td> <td align="center">1-5</td> </tr> </tbody> </table>			Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.	A	WO 2015/103507 A1 (BRISTOL-MYERS SQUIBB COMPANY) 09 July 2015, entire text & JP 2017-509689 A & US 2016/0326104 A1 & EP 3092215 A1	1-5	A	WO 2015/103508 A1 (BRISTOL-MYERS SQUIBB COMPANY) 09 July 2015, entire text & JP 2017-508782 A & US 2016/0326103 A1 & EP 3092216 A1	1-5	A	JP 2015-514794 A (GLAXO GROUP LIMITED) 21 May 2015, entire text & US 2015/0065507 A1 & WO 2013/160419 A1 & EP 2841430 A1	1-5
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.												
A	WO 2015/103507 A1 (BRISTOL-MYERS SQUIBB COMPANY) 09 July 2015, entire text & JP 2017-509689 A & US 2016/0326104 A1 & EP 3092215 A1	1-5												
A	WO 2015/103508 A1 (BRISTOL-MYERS SQUIBB COMPANY) 09 July 2015, entire text & JP 2017-508782 A & US 2016/0326103 A1 & EP 3092216 A1	1-5												
A	JP 2015-514794 A (GLAXO GROUP LIMITED) 21 May 2015, entire text & US 2015/0065507 A1 & WO 2013/160419 A1 & EP 2841430 A1	1-5												
<p><input checked="" type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of Box C. <input type="checkbox"/> See patent family annex.</p>														
<p>* Special categories of cited documents:</p> <table style="width:100%; border:none;"> <tr> <td style="width:50%; vertical-align: top;"> <input type="checkbox"/> document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance <input type="checkbox"/> earlier application or patent but published on or after the international filing date <input type="checkbox"/> document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) <input checked="" type="checkbox"/> document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means <input type="checkbox"/> document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed </td> <td style="width:50%; vertical-align: top;"> <input type="checkbox"/> later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention <input checked="" type="checkbox"/> document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone <input checked="" type="checkbox"/> document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art <input checked="" type="checkbox"/> document member of the same patent family </td> </tr> </table>			<input type="checkbox"/> document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance <input type="checkbox"/> earlier application or patent but published on or after the international filing date <input type="checkbox"/> document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) <input checked="" type="checkbox"/> document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means <input type="checkbox"/> document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed	<input type="checkbox"/> later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention <input checked="" type="checkbox"/> document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone <input checked="" type="checkbox"/> document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art <input checked="" type="checkbox"/> document member of the same patent family										
<input type="checkbox"/> document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance <input type="checkbox"/> earlier application or patent but published on or after the international filing date <input type="checkbox"/> document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) <input checked="" type="checkbox"/> document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means <input type="checkbox"/> document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed	<input type="checkbox"/> later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention <input checked="" type="checkbox"/> document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone <input checked="" type="checkbox"/> document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art <input checked="" type="checkbox"/> document member of the same patent family													
<p>Date of the actual completion of the international search 01 October 2018 (01.10.2018)</p>		<p>Date of mailing of the international search report 16 October 2018 (16.10.2018)</p>												
<p>Name and mailing address of the ISA/ Japan Patent Office 3-4-3, Kasumigaseki, Chiyoda-ku, Tokyo 100-8915, Japan</p>		<p>Authorized officer</p> <p>Telephone No.</p>												

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2018/028277

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	JP 2015-521193 A (PHENEX PHARMACEUTICALS AG) 27 July 2015, entire text & US 2015/0175562 A1 & WO 2013/178362 A1 & EP 2855440 A1	1-5
A	FAUBER, B. P. et al., "Discovery of 1-{4-[3-Fluoro-4((3S, 6R)-3-methyl-1, 1-dioxo-6-phenyl-[1, 2]thiazinan-2-ylmethyl)-phenyl]-piperazin-1-yl}-ethanone(GNE-3500): a potent, Selective, and Orally Bioavailable Retinoic Acid Receptor-Related Orphan Receptor C (RORc or RORγ) Inverse Agonist", Journal of Medicinal Chemistry, 2015, 58(13), pp. 5308-5322	1-5
P, A	WO 2017/131156 A1 (TORAY INDUSTRIES, INC.) 03 August 2017, entire text & TW 201731816 A	1-5

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int.Cl. A61K31/451(2006.01)i, A61K8/49(2006.01)i, A61K31/4525(2006.01)i, A61K31/454(2006.01)i, A61P17/14(2006.01)i, A61Q7/00(2006.01)i

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int.Cl. A61K31/451, A61K8/49, A61K31/4525, A61K31/454, A61P17/14, A61Q7/00

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

日本国実用新案公報	1922-1996年
日本国公開実用新案公報	1971-2018年
日本国実用新案登録公報	1996-2018年
日本国登録実用新案公報	1994-2018年

国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)

JSTPlus/JMEDPlus/JST7580 (JDreamIII), CPlus/REGISTRY/MEDLINE/EMBASE/BIOSIS (STN)

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求項の番号
A	WO 2015/103507 A1 (BRISTOL-MYERS SQUIBB COMPANY) 2015.07.09, 全文 & JP 2017-509689 A & US 2016/0326104 A1 & EP 3092215 A1	1-5
A	WO 2015/103508 A1 (BRISTOL-MYERS SQUIBB COMPANY) 2015.07.09, 全文 & JP 2017-508782 A & US 2016/0326103 A1 & EP 3092216 A1	1-5
A	JP 2015-514794 A (グラクソ グループ リミテッド) 2015.05.21, 全文 & US 2015/0065507 A1 & WO 2013/160419 A1 & EP 2841430 A1	1-5

☑ C欄の続きにも文献が列挙されている。

☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

「A」 特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの	「T」 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの
「E」 国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの	「X」 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの
「L」 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)	「Y」 特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの
「O」 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献	「&」 同一パテントファミリー文献
「P」 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願	

国際調査を完了した日

01.10.2018

国際調査報告の発送日

16.10.2018

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/J P)
郵便番号 100-8915
東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

石井 裕美子

4C

3402

電話番号 03-3581-1101 内線 3452

C (続き) . 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求項の番号
A	JP 2015-521193 A (フェネックス ファーマシューティカルス アーゲー) 2015.07.27, 全文 & US 2015/0175562 A1 & WO 2013/178362 A1 & EP 2855440 A1	1-5
A	FAUBER, B. P. et al., Discovery of 1- {4- [3-Fluoro- 4((3S,6R)- 3-methyl- 1,1 -dioxo-6-phenyl- [1,2]thiazinan-2- ylmethyl)- phenyl]-piperazin-1- yl-ethanone(GNE-3500): a Potent, Selective, and Orally Bioavailable Retinoic Acid Receptor-Related Orphan Receptor C(RORc or ROR γ) Inverse Agonist, Journal of Medicinal Chemistry, 2015, 58(13), pp.5308-5322	1-5
P, A	WO 2017/131156 A1 (東レ株式会社) 2017.08.03, 全文 & TW 201731816 A	1-5