

【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26年9月25日(2014.9.25)

【公表番号】特表2013-536853(P2013-536853A)

【公表日】平成25年9月26日(2013.9.26)

【年通号数】公開・登録公報2013-052

【出願番号】特願2013-527248(P2013-527248)

【国際特許分類】

C 0 7 D 403/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/517 (2006.01)

A 6 1 K 9/20 (2006.01)

A 6 1 K 9/48 (2006.01)

A 6 1 K 47/34 (2006.01)

A 6 1 K 9/72 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/02 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 13/12 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 403/12 C S P

A 6 1 K 31/517

A 6 1 K 9/20

A 6 1 K 9/48

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 9/72

A 6 1 P 43/00 1 0 5

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 35/02

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 13/12

【手続補正書】

【提出日】平成26年8月7日(2014.8.7)

【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】

光学活性のある(R)-(4-フルオロフェニル)(4-((5-メチル-1H-ピラゾール-3-イル)アミノ)キナゾリン-2-イル)メタノール若しくはその同位体変種；又は、それらの医薬として許容し得る塩、溶媒和物、水和物、若しくはプロドラッグ。

【請求項2】

前記化合物が塩である、請求項1記載の化合物。

【請求項3】

前記塩が塩酸塩である、請求項2記載の化合物。

【請求項 4】

前記塩がエシル酸塩である、請求項2記載の化合物。

【請求項 5】

約10%以上の鏡像体過剰率を有する、請求項1記載の化合物。

【請求項 6】

約95%以上の鏡像体過剰率を有する、請求項5記載の化合物。

【請求項 7】

前記化合物が実質的に純粋である、請求項1記載の化合物。

【請求項 8】

前記化合物が、少なくとも約50%の純度を有する、請求項7記載の化合物。

【請求項 9】

前記化合物が、少なくとも約90%の純度を有する、請求項7記載の化合物。

【請求項 10】

前記化合物が、JAK2を選択的に阻害する、請求項9記載の化合物。

【請求項 11】

前記化合物が、JAK3よりもJAK2を選択的に阻害する、請求項10記載の化合物。

【請求項 12】

請求項1記載の化合物、及び医薬として許容し得る賦形剤を含有する、医薬組成物。

【請求項 13】

前記組成物が、経口、経鼻、経気管支、又は局所投与のために製剤化される、請求項12記載の医薬組成物。

【請求項 14】

前記組成物が、単回剤形として製剤化される、請求項12記載の医薬組成物。

【請求項 15】

前記組成物が、経口、非経口、経鼻、経呼吸器、肺内、又は静脈内剤形として製剤化される、請求項12記載の医薬組成物。

【請求項 16】

前記経口剤形が、錠剤又はカプセル剤である、請求項15記載の医薬組成物。

【請求項 17】

前記医薬として許容し得る賦形剤が、PEG 400である、請求項12記載の医薬組成物。

【請求項 18】

前記医薬として許容し得る賦形剤が、水である、請求項12記載の医薬組成物。

【請求項 19】

前記組成物が、静脈内投与のために製剤化される、請求項17記載の医薬組成物。

【請求項 20】

請求項1記載の化合物を含む、対象における増殖性疾患の1つ以上の症状を治療、予防、又は改善するための医薬組成物。

【請求項 21】

前記増殖性疾患が癌である、請求項20記載の医薬組成物。

【請求項 22】

前記増殖性疾患が、白血病である、請求項20記載の医薬組成物。

【請求項 23】

前記増殖性疾患が、炎症疾患である、請求項20記載の医薬組成物。

【請求項 24】

請求項1記載の化合物を含む、対象におけるJAK-媒介性状態、障害、又は疾患の1つ以上の症状を治療、予防、又は改善するための医薬組成物。

【請求項 25】

前記JAK-媒介性状態、障害、又は疾患が癌である、請求項24記載の医薬組成物。

【請求項 26】

前記JAK-媒介性状態、障害、又は疾患が白血病である、請求項24記載の医薬組成物。

【請求項 27】

前記JAK-媒介性状態、障害、又は疾患が炎症疾患である、請求項24記載の医薬組成物。

【請求項 28】

請求項1記載の化合物を含む、細胞の増殖を阻害するための医薬組成物。

【請求項 29】

前記細胞が、癌性細胞である、請求項28記載の医薬組成物。

【請求項 30】

請求項1記載の化合物を含む、JAKキナーゼの活性を調節するための医薬組成物。

【請求項 31】

前記キナーゼが構成的に活性化される、請求項30記載の医薬組成物。

【請求項 32】

ラセミ体(4-フルオロフェニル)(4-(5-メチル-1H-ピラゾール-3-イルアミノ)キナゾリン-2-イル)メタノールをキラルクロマトグラフィーにより分割することを含む、光学活性のある(R)-(4-フルオロフェニル)(4-((5-メチル-1H-ピラゾール-3-イル)アミノ)キナゾリン-2-イル)メタノール若しくはその同位体変種；又は、それらの医薬として許容し得る塩、溶媒和物、水和物、若しくはプロドラッグの製造方法。

【請求項 33】

(4-フルオロフェニル)(4-(5-メチル-1H-ピラゾール-3-イルアミノ)キナゾリン-2-イル)メタノールを、キラル触媒の存在下で、水素化する工程を含む、光学活性のある(R)-(4-フルオロフェニル)(4-((5-メチル-1H-ピラゾール-3-イル)アミノ)キナゾリン-2-イル)メタノール若しくはその同位体変種；又は、それらの医薬として許容し得る塩、溶媒和物、水和物、若しくはプロドラッグの製造方法。

【請求項 34】

前記キラル触媒が、[(S)-P-Phos RuCl₂ (S)-DAIPEN]である、請求項33記載の方法。