

【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30年1月18日(2018.1.18)

【公表番号】特表2017-509585(P2017-509585A)

【公表日】平成29年4月6日(2017.4.6)

【年通号数】公開・登録公報2017-014

【出願番号】特願2016-541595(P2016-541595)

【国際特許分類】

| | | |
|--------|--------|-----------|
| C 07 K | 5/12 | (2006.01) |
| A 61 K | 38/00 | (2006.01) |
| C 07 D | 241/44 | (2006.01) |
| A 61 P | 31/14 | (2006.01) |
| A 61 P | 1/16 | (2006.01) |
| C 07 C | 231/12 | (2006.01) |
| C 07 C | 271/34 | (2006.01) |
| C 07 C | 205/57 | (2006.01) |
| C 07 C | 255/61 | (2006.01) |
| C 07 C | 233/07 | (2006.01) |
| C 07 C | 233/06 | (2006.01) |
| C 07 C | 251/12 | (2006.01) |
| C 07 D | 453/04 | (2006.01) |
| C 07 B | 61/00 | (2006.01) |

【F I】

| | | |
|--------|--------|-------|
| C 07 K | 5/12 | |
| A 61 K | 37/02 | |
| C 07 D | 241/44 | C S P |
| A 61 P | 31/14 | |
| A 61 P | 1/16 | |
| C 07 C | 231/12 | |
| C 07 C | 271/34 | |
| C 07 C | 205/57 | |
| C 07 C | 255/61 | |
| C 07 C | 233/07 | |
| C 07 C | 233/06 | |
| C 07 C | 251/12 | |
| C 07 D | 453/04 | |
| C 07 B | 61/00 | 3 0 0 |

【手続補正書】

【提出日】平成29年11月30日(2017.11.30)

【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

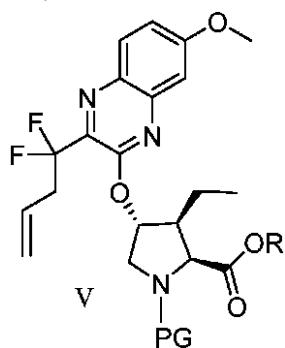
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

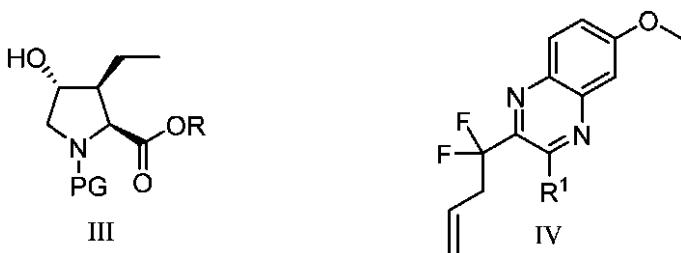
【請求項1】

式Vの化合物、

【化242】



またはその塩を調製する方法であって、
式I I Iの化合物またはその塩を、式I Vの化合物
【化243】

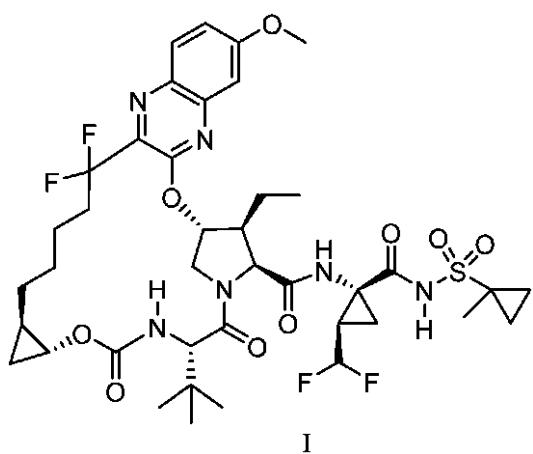


と、O - アリール化条件下で接触させて、該式Vの化合物またはその塩を提供するステップを含み、
式中、Rは、C₁ ~ C₆アルキルであり、PGは、保護基であり、R¹は、脱離基である、
方法。

【請求項2】

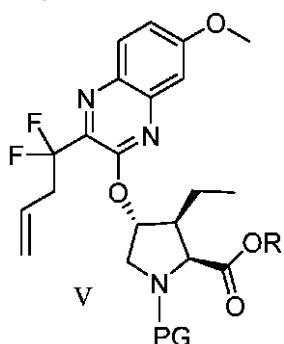
式Iの化合物、

【化251】



またはその薬学的に許容される塩を調製する方法であって、
a) 請求項1に記載の方法に従って式Vの化合物、

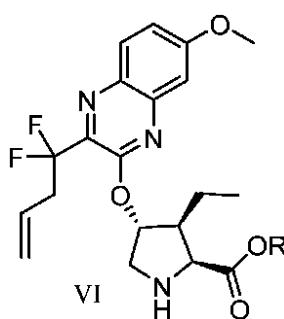
【化 2 5 3】



またはその塩を調製するステップと、

b) 該式 V の化合物またはその塩を、N - 脱保護条件に付して、式 V I の化合物、

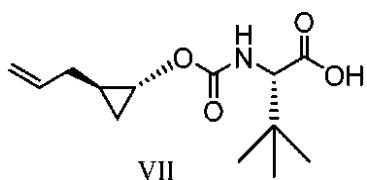
【化 2 5 4】



またはその塩を提供するステップと、

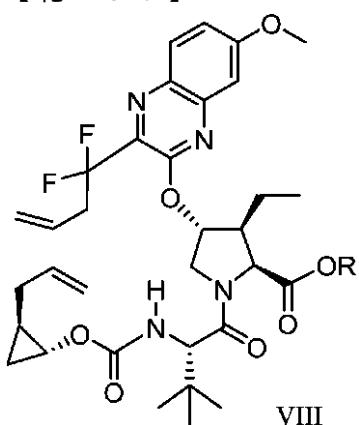
c) 該式 V I の化合物またはその塩を、式 V I I の化合物、

【化 2 5 5】



またはその塩と、アミドカップリング条件下で接触させて、式 V I I I の化合物、

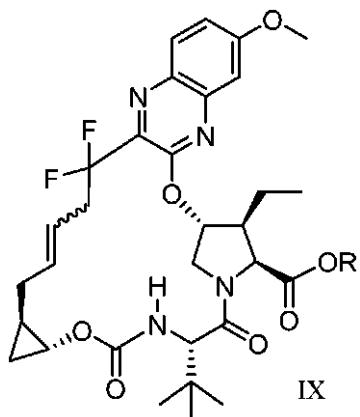
【化 2 5 6】



またはその塩を提供するステップと、

d) 該式 V I I I の化合物またはその塩の閉環メタセシスを実施して、式 I X の化合物、

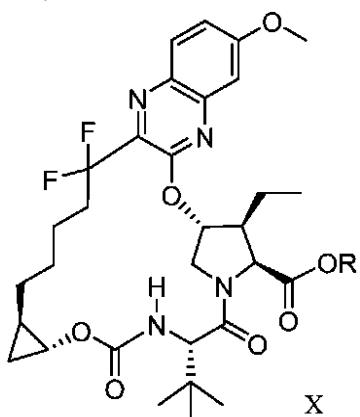
【化257】



またはその塩を提供するステップと、

e) 該式IXの化合物またはその塩を、触媒の存在下で水素化して、式Xの化合物、

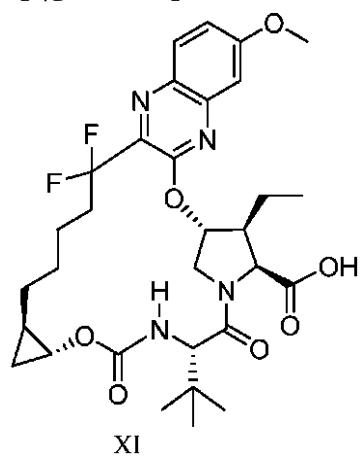
【化258】



またはその塩を提供するステップと、

f) 該式Xの化合物またはその塩を加水分解して、式XIの化合物、

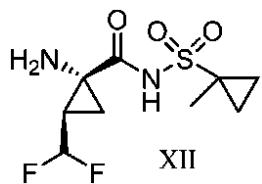
【化259】



またはその塩を提供するステップと、

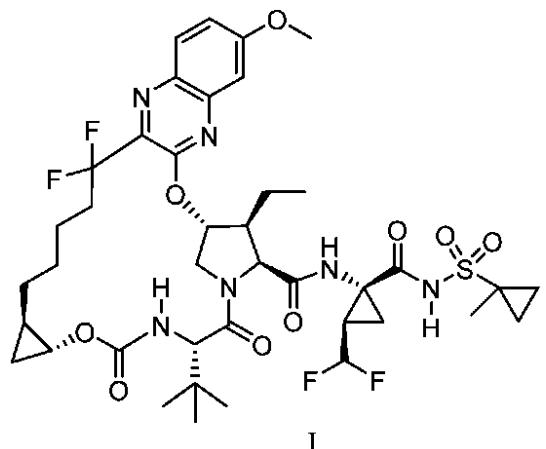
g) 該式XIの化合物またはその塩を、式XIIの化合物、

【化260】



またはその塩と、アミドカップリング条件下で接触させて、該式Iの化合物、

【化261】



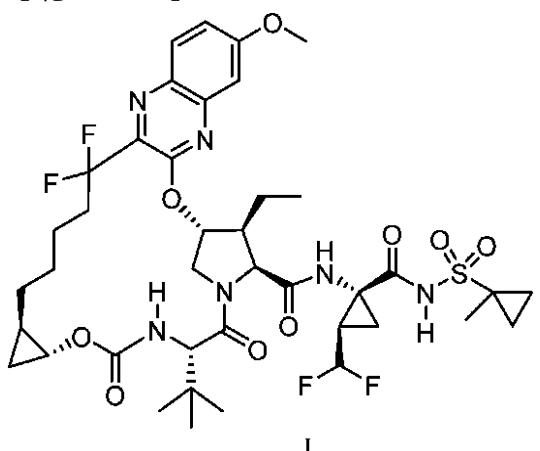
またはその薬学的に許容される塩を提供するステップと
を含み、

式中、Rは、 $\text{C}_{1\sim 6}$ アルキルであり、PGは、保護基であり、 R^1 は、脱離基である、
方法。

【請求項3】

式Iの化合物、

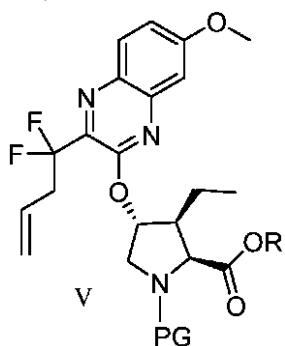
【化268】



またはその薬学的に許容される塩を調製する方法であって、

a) 請求項1に記載の方法に従って式Vの化合物、

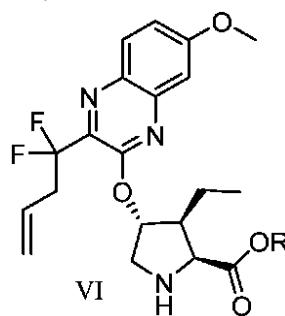
【化270】



またはその塩を調製するステップと、

b) 該式Vの化合物またはその塩を、酸と、N-脱保護条件下で接触させて、式VIの化合物、

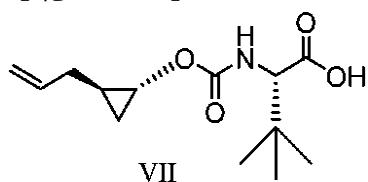
【化271】



またはその塩を提供するステップと、

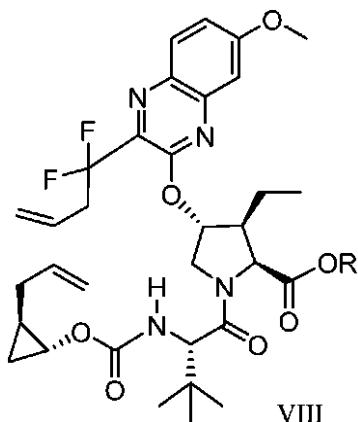
c) 該式VIの化合物またはその塩を、式VIIの化合物、

【化272】



またはその塩と、アミドカップリング条件下で接触させて、式VIIIの化合物、

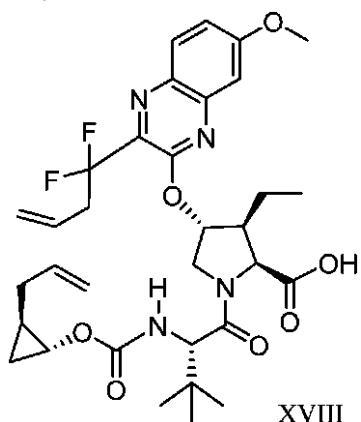
【化273】



またはその塩を提供するステップと、

d) 該式VIIIの化合物またはその塩を加水分解して、式XVIIIの化合物、

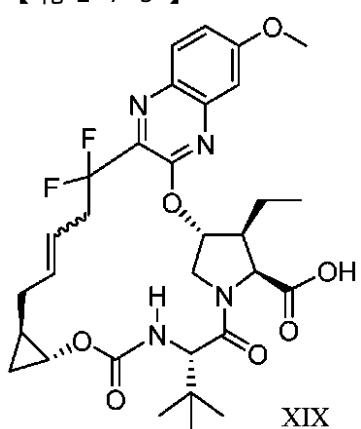
【化274】



またはその塩を提供するステップと、

e) 該式XVIIの化合物またはその塩の閉環メタセシスを、触媒の存在下で実施して、式XIXの化合物、

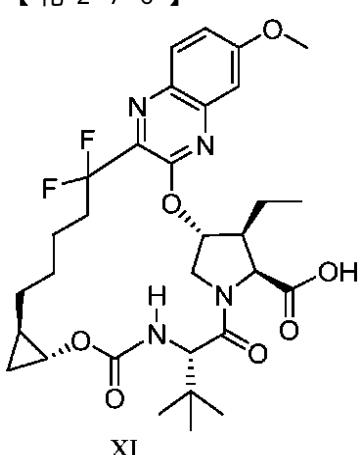
【化275】



またはその塩を提供するステップと、

f) 該式XIXの化合物を、触媒の存在下で水素化して、式XIの化合物、

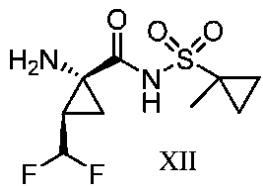
【化276】



またはその塩を提供するステップと、

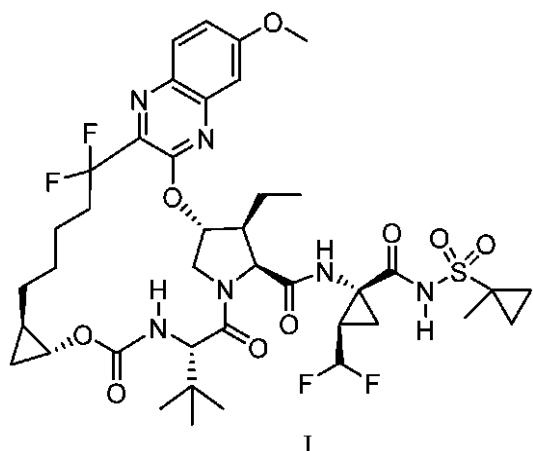
g) 該式XIの化合物またはその塩を、式XIIの化合物、

【化277】



またはその塩と、アミドカップリング条件下で接触させて、該式Iの化合物、

【化278】



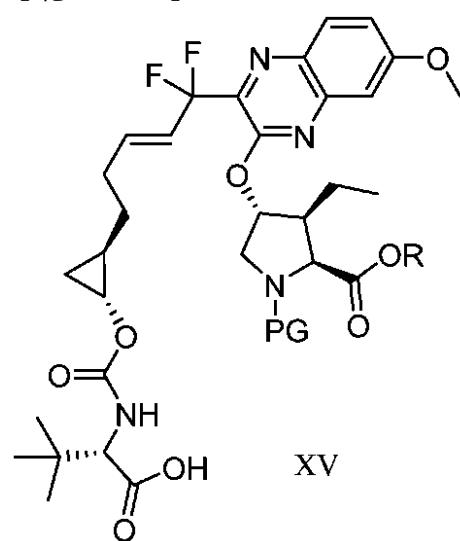
またはその薬学的に許容される塩を提供するステップと
を含み、

式中、Rは、C₁~₆アルキルであり、PGは、保護基であり、R¹は、脱離基である、
方法。

【請求項4】

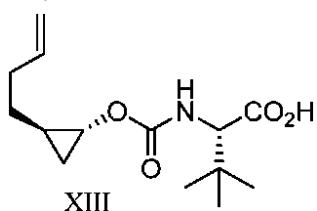
式XVの化合物、

【化279】



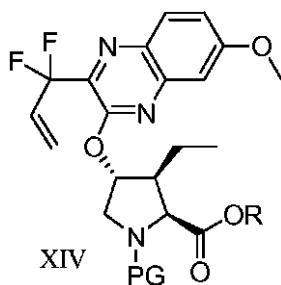
またはその塩を調製する方法であって、式XIIIの化合物、

【化280】



またはその塩を、式XIVの化合物、

【化281】



またはその塩と、クロスメタセシス条件下で接触させて、該式XVの化合物またはその塩を提供するステップを含み、

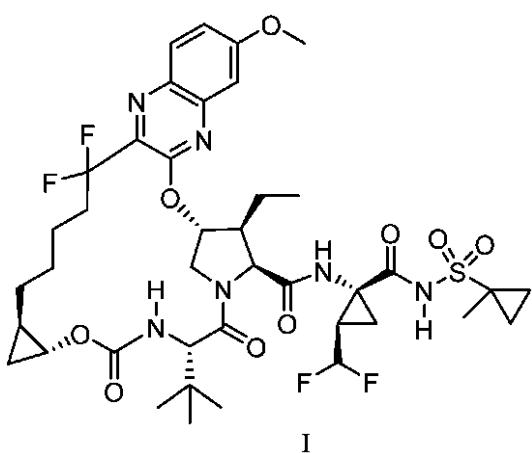
式中、Rは、C₁~₆アルキルであり、PGは、保護基である、

方法。

【請求項5】

式Iの化合物、

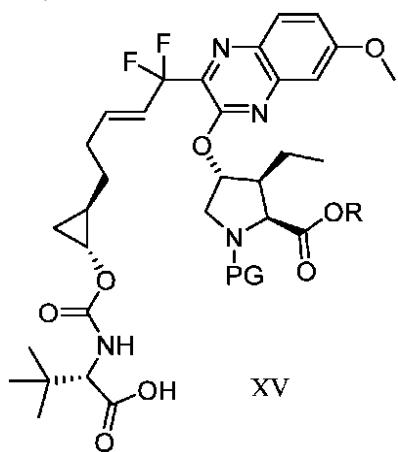
【化287】



またはその薬学的に許容される塩を調製する方法であって、

a) 請求項4に記載の方法に従って式XVの化合物、

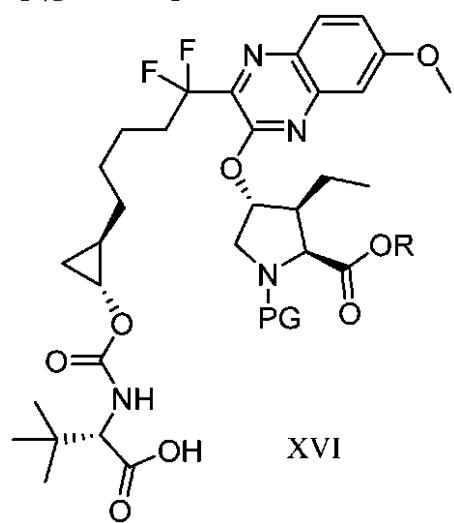
【化290】



またはその塩を調製するステップと、

b) 該式XVの化合物またはその塩を、触媒の存在下で水素化して、式XVIの化合物、

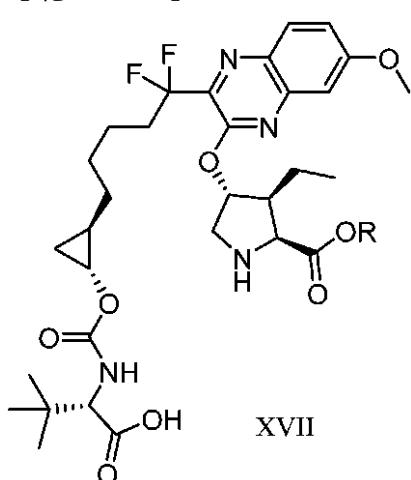
【化291】



またはその塩を提供するステップと、

c) 該式XVIの化合物またはその塩を、N - 脱保護条件に付して、式XVIIの化合物

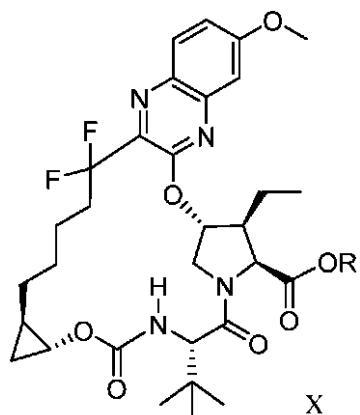
【化292】



またはその塩を提供するステップと、

d) 該式 X V I I の化合物を、アミドカップリング剤と、ラクタム化条件下で接触させて、式 X の化合物、

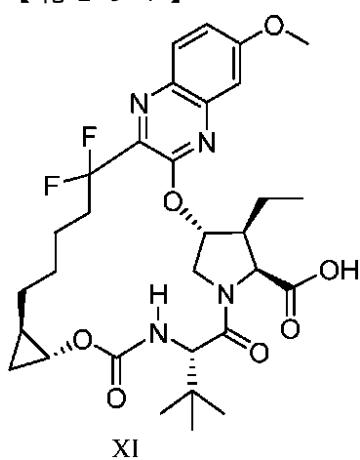
【化 2 9 3】



またはその塩を得るステップと、

e) 該式 X の化合物またはその塩を加水分解して、式 X I の化合物、

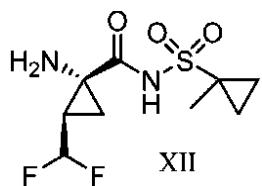
【化 2 9 4】



またはその塩を提供するステップと、

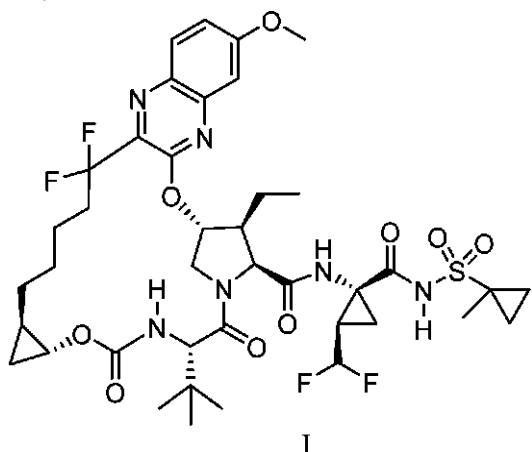
f) 該式 X I の化合物またはその塩を、式 X I I の化合物、

【化 2 9 5】



またはその塩と、アミドカップリング条件下で接触させて、該式 I の化合物、

【化296】



またはその塩を提供するステップと
を含み、
式中、Rは、C₁~₆アルキルであり、PGは、保護基である、
方法。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0041

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0041】

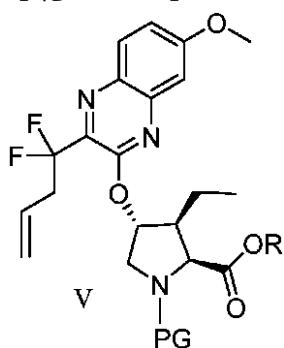
より具体的な実施形態を、以下に説明する。

本発明の実施形態において、例えば以下の項目が提供される。

(項目1)

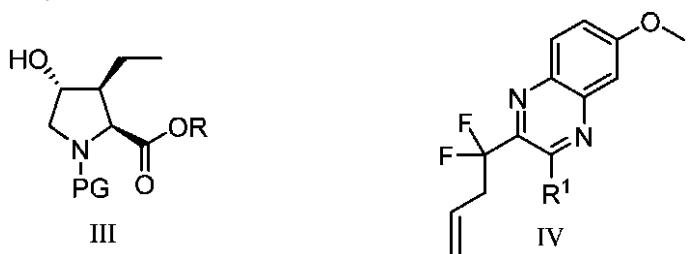
式Vの化合物、

【化242】



またはその共結晶、もしくは塩を調製する方法であって、
式IIの化合物またはその共結晶、もしくは塩を、式IVの化合物

【化243】

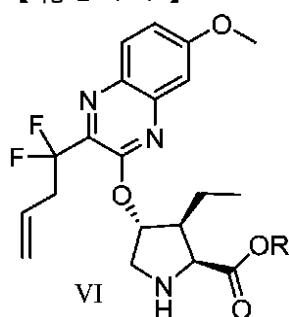


と、O - アリール化条件下で接触させて、該式Vの化合物またはその共結晶、もしくは塩(式中、Rは、C₁~₆アルキルであり、PGは、保護基であり、R¹は、脱離基である)を提供するステップを含む、方法。

(項目2)

式V I の化合物、

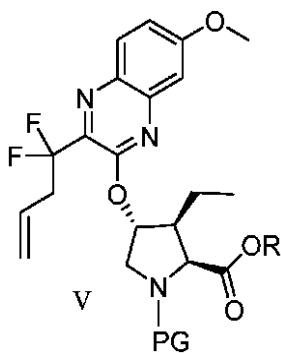
【化244】



またはその共結晶、もしくは塩を調製する方法であって、

式Vの化合物、

【化245】

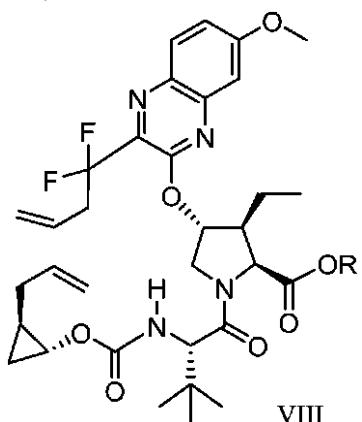


またはその共結晶、もしくは塩を、N - 脱保護条件に付して、該式V I の化合物またはその共結晶、もしくは塩(式中、Rは、C₁~₆アルキルであり、PGは、保護基である)を提供するステップを含む、方法。

(項目3)

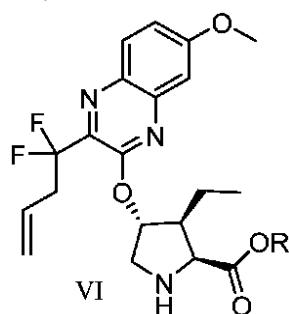
式V I I I の化合物、

【化246】



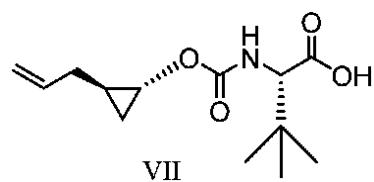
またはその共結晶、もしくは塩を調製する方法であって、
式V I の化合物、

【化247】



またはその共結晶、もしくは塩を、
式V I I の化合物、

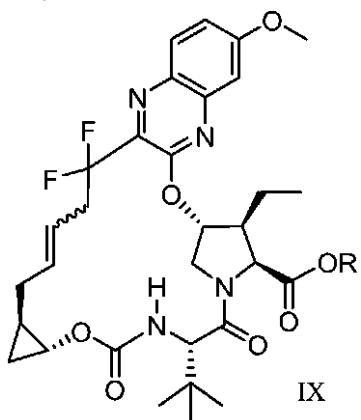
【化248】



またはその共結晶、もしくは塩と、アミドカップリング条件下で接觸させて、該式V I I
Iの化合物またはその共結晶、もしくは塩（式中、Rは、C₁～₆アルキルである）を提
供するステップを含む、方法。

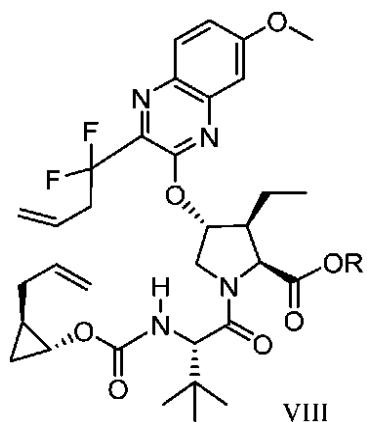
（項目4）式IXの化合物、

【化 2 4 9】



またはその共結晶、もしくは塩を調製する方法であって、
式 V I I I の化合物、

【化 2 5 0】

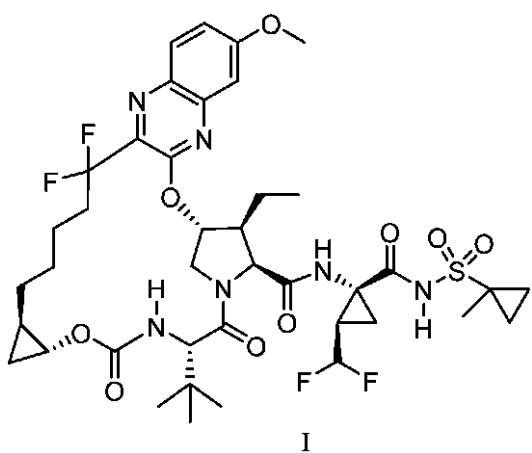


またはその共結晶、もしくは塩の閉環メタセシスを実施して、該式 I X の化合物またはそ
の共結晶、もしくは塩（式中、R は、C₁ ~ ₆ アルキルである）を提供するステップを含
む、方法。

（項目 5）

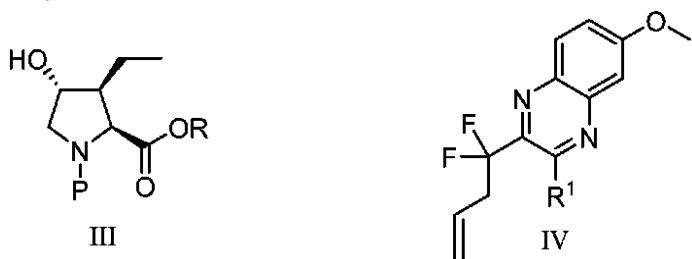
式 I の化合物、

【化 2 5 1】

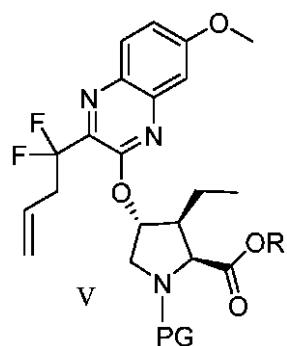


またはその共結晶、もしくは薬学的に許容される塩を調製する方法であって、
a) 式 I I I の化合物またはその共結晶、もしくは塩を、式 I V の化合物

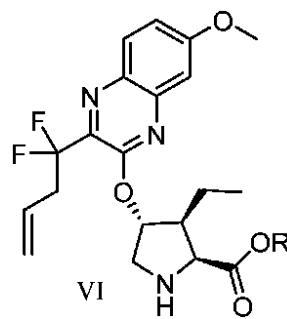
【化252】

と、O - アリール化条件下で接触させて、式Vの化合物、

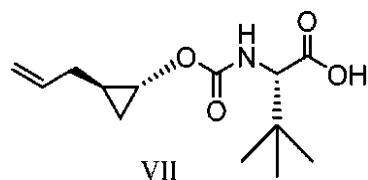
【化253】

またはその共結晶、もしくは塩を提供するステップと、b) 該式Vの化合物またはその共結晶、もしくは塩を、N - 脱保護条件に付して、式VIの化合物、

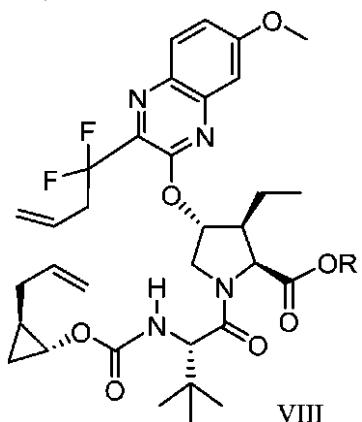
【化254】

またはその共結晶、もしくは塩を提供するステップと、c) 該式VIの化合物またはその共結晶、もしくは塩を、式VIIの化合物、

【化255】

またはその共結晶、もしくは塩と、アミドカップリング条件下で接触させて、式VIIIの化合物、

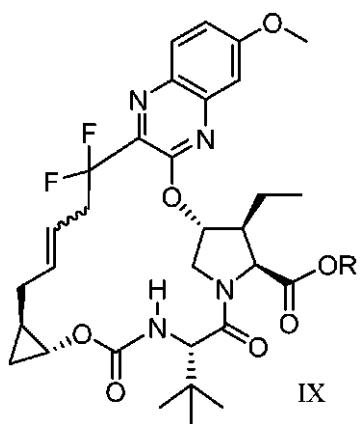
【化256】



またはその共結晶、もしくは塩を提供するステップと、

d) 該式VIIの化合物またはその共結晶、もしくは塩の閉環メタセシスを実施して、式IXの化合物、

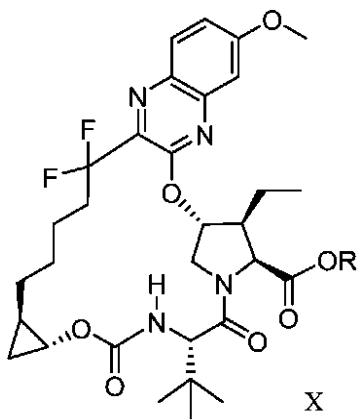
【化257】



またはその共結晶、もしくは塩を提供するステップと、

e) 該式IXの化合物またはその共結晶、もしくは塩を、触媒の存在下で水素化して、式Xの化合物、

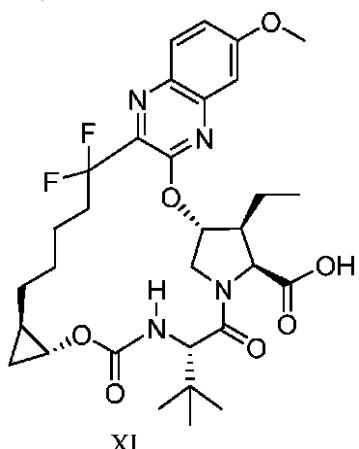
【化258】



またはその共結晶、もしくは塩を提供するステップと、

f) 該式Xの化合物またはその共結晶、もしくは塩を加水分解して、式XIの化合物、

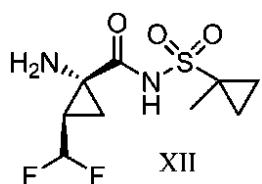
【化259】



またはその共結晶、もしくは塩を提供するステップと、

g) 該式 XI の化合物またはその共結晶、もしくは塩を、式 XII の化合物、

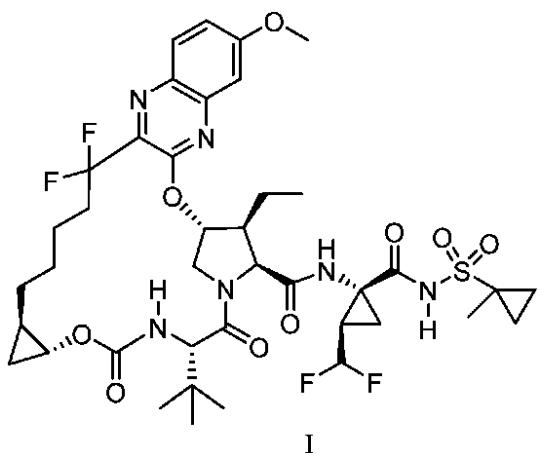
【化260】



またはその共結晶、もしくは塩と、アミドカップリング条件下で接触させて、該式 I の化

合物、

【化261】



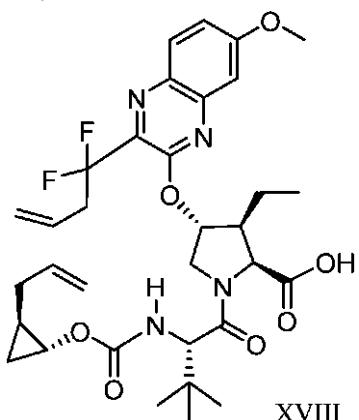
またはその共結晶、もしくは薬学的に許容される塩（式中、R は、C₁ ~ 6 アルキルであ
り、PG は、保護基であり、R¹ は、脱離基である）を提供するステップと

を含む、方法。

(項目6)

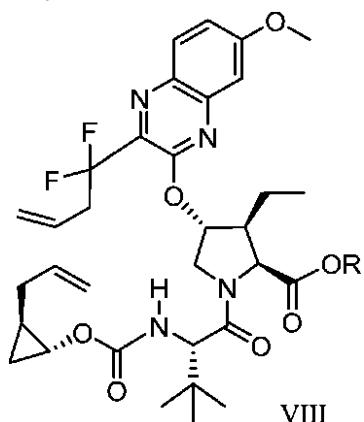
式 XVIII の化合物、

【化262】



またはその共結晶、もしくは塩を調製する方法であって、
式VIIの化合物、

【化263】

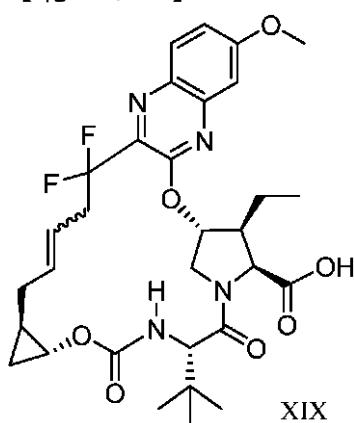


またはその共結晶、もしくは塩を加水分解して、該式VIIの化合物またはその共結晶、もしくは塩（式中、Rは、C₁～₆アルキルである）を提供するステップを含む、方法。

(項目7)

式IXの化合物、

【化264】



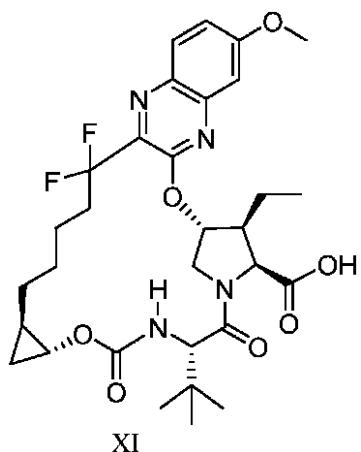
またはその共結晶、もしくは塩を調製する方法であって、

前記式VIIの化合物またはその共結晶、もしくは塩の閉環メタセシスを、触媒の存在下で実施して、該式IXの化合物を提供するステップを含む、方法。

(項目8)

式 X I の化合物、

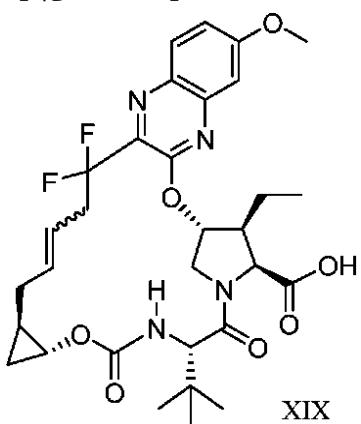
【化 2 6 5】



またはその共結晶、もしくは塩を調製する方法であって、

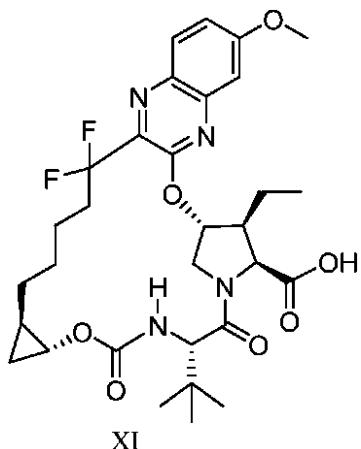
式 X I X の化合物、

【化 2 6 6】



またはその共結晶、もしくは塩を、触媒の存在下で水素化して、式 X I の化合物、

【化 2 6 7】

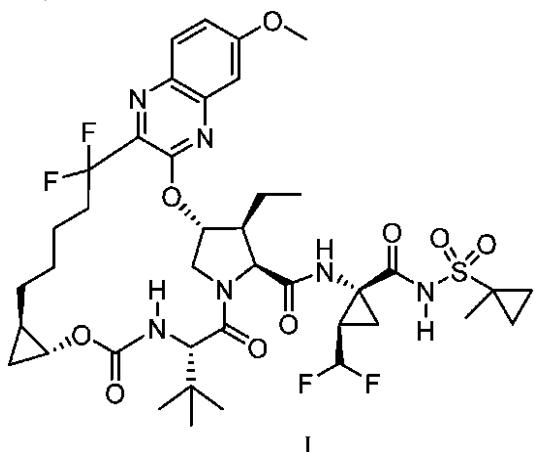


またはその共結晶、もしくは塩を提供するステップを含む、方法。

(項目 9)

式 I の化合物、

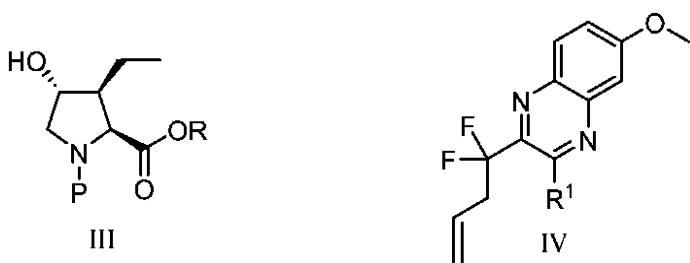
【化268】



またはその共結晶、もしくは薬学的に許容される塩を調製する方法であつて、

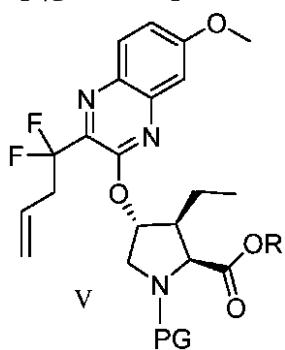
a) 式 I III の化合物またはその共結晶、もしくは塩を、式 IV の化合物

【化269】



と、O - アリール化条件下で接触させて、式 V の化合物、

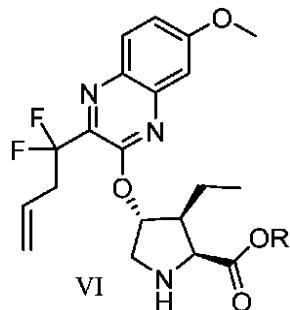
【化270】



またはその共結晶、もしくは塩を提供するステップと、

b) 該式 V の化合物またはその共結晶、もしくは塩を、酸と、N - 脱保護条件下で接触させて、式 VI の化合物、

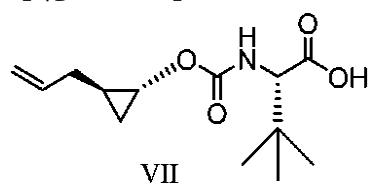
【化271】



またはその共結晶、もしくは塩を提供するステップと、

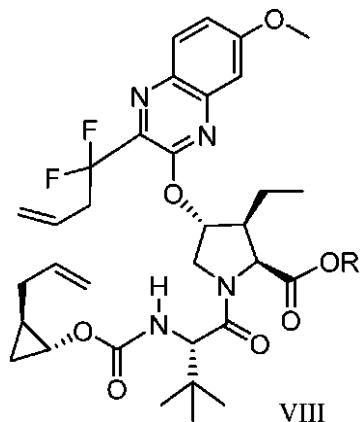
c) 該式VIIの化合物またはその共結晶、もしくは塩を、式VIIの化合物、

【化272】



またはその共結晶、もしくは塩と、アミドカップリング条件下で接触させて、式VIIIの化合物、

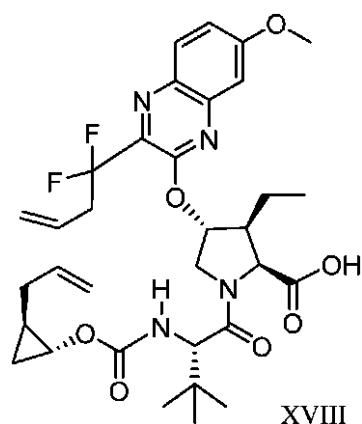
【化273】



またはその共結晶、もしくは塩を提供するステップと、

d) 該式VIIIの化合物またはその共結晶、もしくは塩を加水分解して、式XVIIIの化合物、

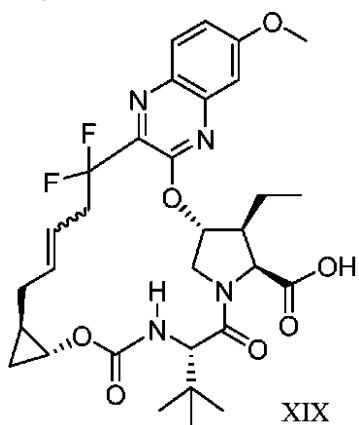
【化274】



またはその共結晶、もしくは塩を提供するステップと、

e) 該式XVIIIの化合物またはその共結晶、もしくは塩の閉環メタセシスを、触媒の存在下で実施して、式XIの化合物、

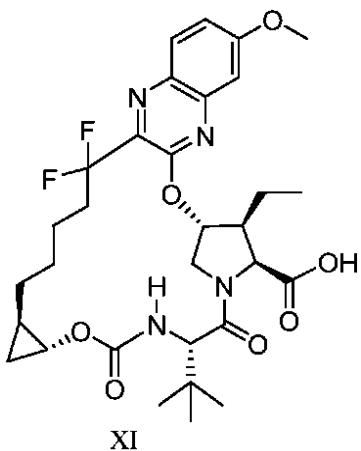
【化275】



またはその共結晶、もしくは塩を提供するステップと、

f) 該式XIXの化合物を、触媒の存在下で水素化して、式XIの化合物、

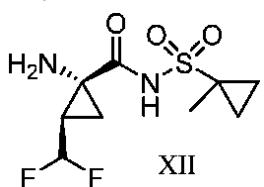
【化276】



またはその共結晶、もしくは塩を提供するステップと、

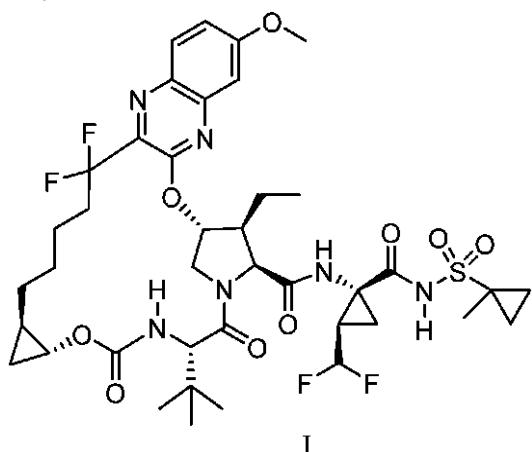
g) 該式XIの化合物またはその共結晶、もしくは塩を、式XIIの化合物、

【化277】



またはその共結晶、もしくは塩と、アミドカップリング条件下で接触させて、該式Iの化合物、

【化278】

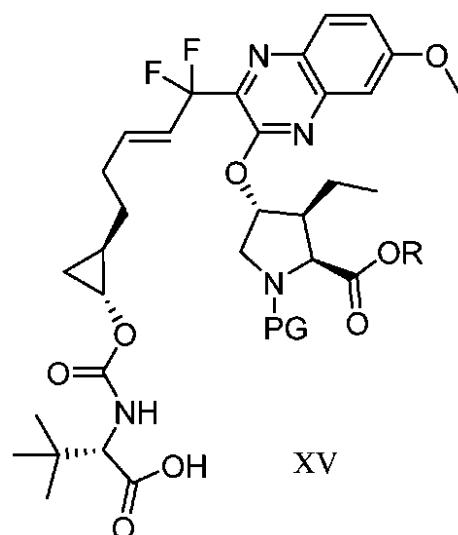


またはその共結晶、もしくは薬学的に許容される塩（式中、Rは、C₁～₆アルキルであり、PGは、保護基であり、R¹は、脱離基である）を提供するステップとを含む、方法。

（項目10）

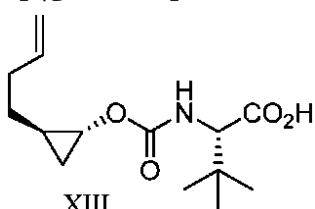
式XVの化合物、

【化279】



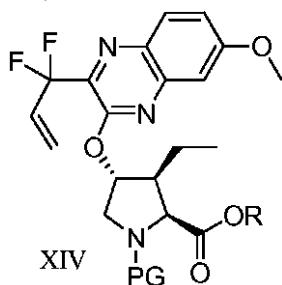
またはその共結晶、もしくは塩を調製する方法であって、式XIIIの化合物、

【化280】



またはその共結晶、もしくは塩を、式XIVの化合物、

【化281】

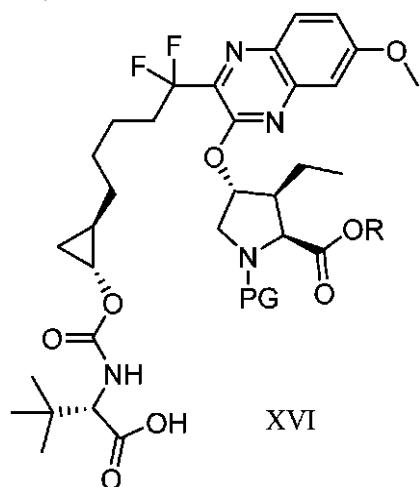


またはその共結晶、もしくは塩と、クロスマタセシス条件下で接触させて、該式XVの化合物またはその共結晶、もしくは塩（式中、Rは、C₁～₆アルキルであり、PGは、保護基である）を提供するステップを含む、方法。

（項目11）

式XVIの化合物、

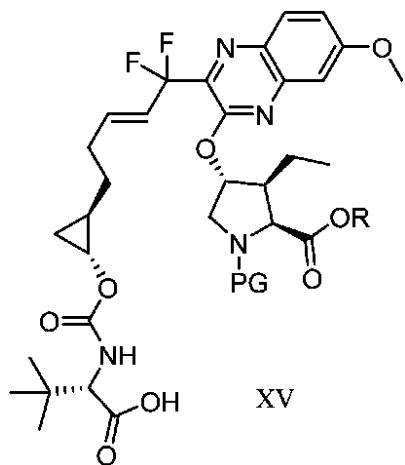
【化282】



またはその共結晶、もしくは塩を調製する方法であって、

前記式XVIの化合物、

【化283】

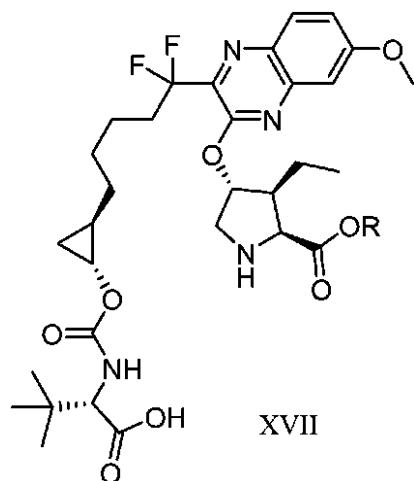


またはその共結晶、もしくは塩を、触媒の存在下で水素化して、該式XVIの化合物またはその共結晶、もしくは塩（式中、Rは、C₁～₆アルキルであり、PGは、保護基である）を提供するステップを含む、方法。

（項目12）

式 X V I I の化合物、

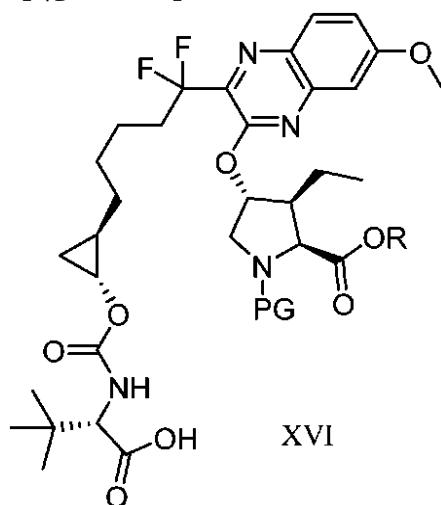
【化 2 8 4】



またはその共結晶、もしくは塩を調製する方法であって、

式 X V I の化合物、

【化 2 8 5】

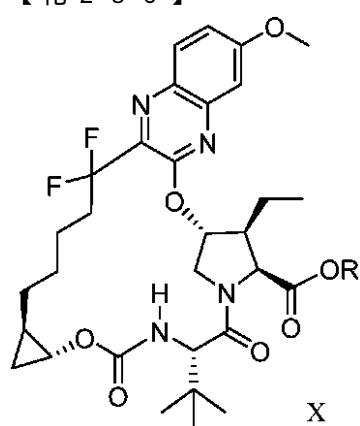


またはその共結晶、もしくは塩を、N - 脱保護条件に付して、該式 X V I I の化合物またはその共結晶、もしくは塩（式中、R は、C₁ ~ ₆ アルキルであり、PG は、保護基である）を提供するステップを含む、方法。

（項目 1 3）

式 X の化合物、

【化 2 8 6】



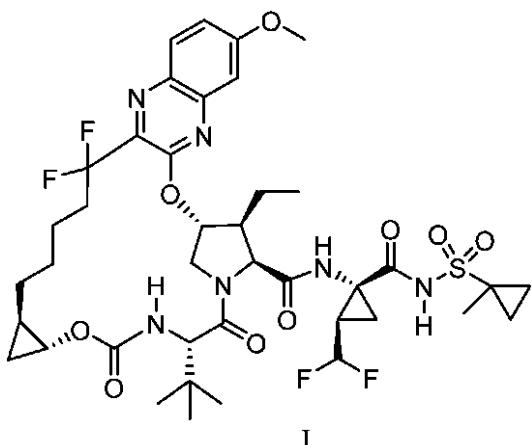
またはその共結晶、もしくは塩を調製する方法であって、

前記式XVIの化合物を、アミドカップリング剤と、ラクタム化条件下で接触させて、
該式Xの化合物またはその共結晶、もしくは塩（式中、Rは、C₁~₆アルキルである）
を得るステップを含む、方法。

（項目14）

式Iの化合物、

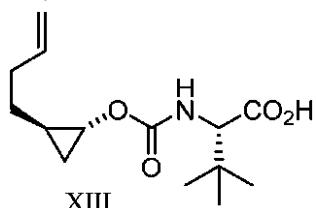
【化287】



またはその共結晶、もしくは薬学的に許容される塩を調製する方法であって、

a) 式XIIIの化合物、

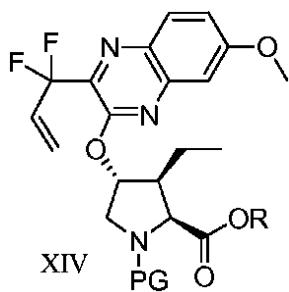
【化288】



またはその共結晶、もしくは塩を、

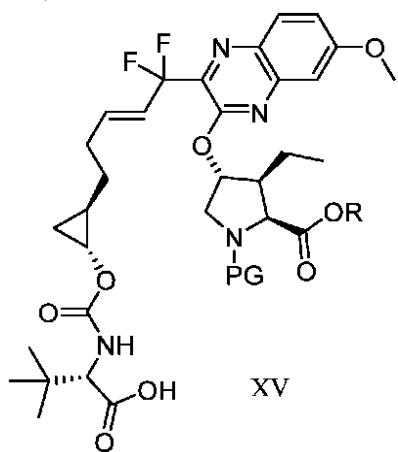
式XIVの化合物、

【化289】



またはその共結晶、もしくは塩と、クロスマタセシス条件下で接触させて、式XVの化合物、

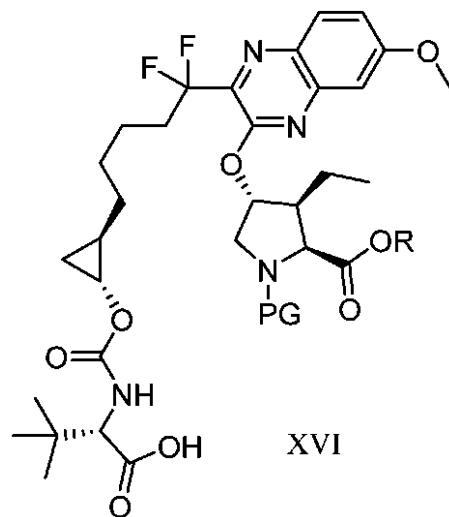
【化290】



またはその共結晶、もしくは塩を提供するステップと、

b) 該式XVの化合物またはその共結晶、もしくは塩を、触媒の存在下で水素化して、式XVIの化合物、

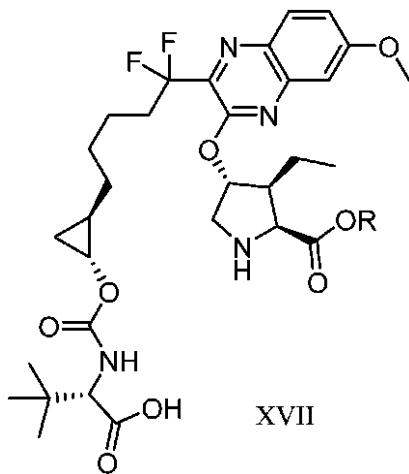
【化291】



またはその共結晶、もしくは塩を提供するステップと、

c) 該式XVIの化合物またはその共結晶、もしくは塩を、N-脱保護条件に付して、式XVIIの化合物、

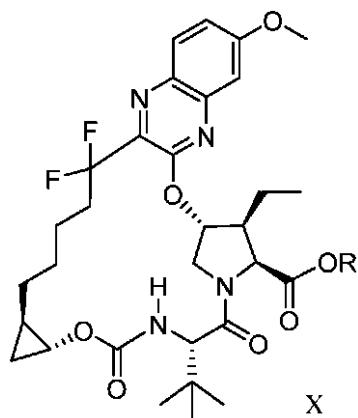
【化292】



またはその共結晶、もしくは塩を提供するステップと、

d) 該式 X V I I の化合物を、アミドカップリング剤と、ラクタム化条件下で接触させて、式 X の化合物、

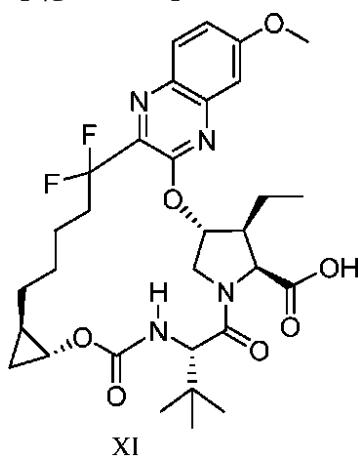
【化 2 9 3】



またはその共結晶、もしくは塩を得るステップと、

e) 該式 X の化合物またはその共結晶、もしくは塩を加水分解して、式 X I の化合物、

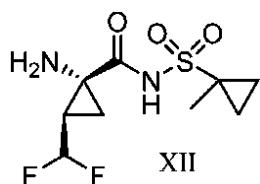
【化 2 9 4】



またはその共結晶、もしくは塩を提供するステップと、

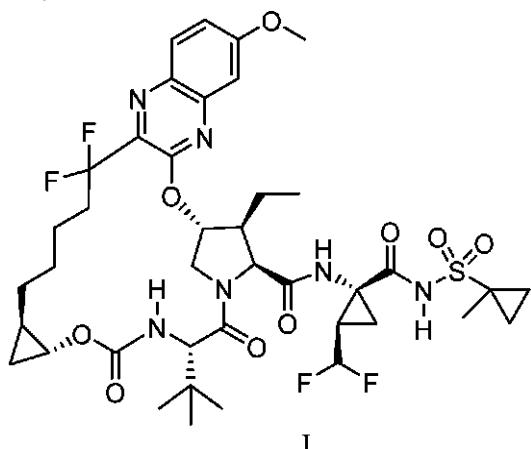
f) 該式 X I の化合物またはその共結晶、もしくは塩を、式 X I I の化合物、

【化 2 9 5】



またはその共結晶、もしくは塩と、アミドカップリング条件下で接触させて、該式 I の化合物、

【化296】

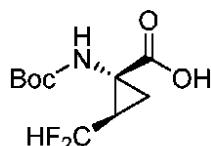


またはその共結晶、もしくは(式中、Rは、C₁~₆アルキルであり、PGは、保護基である)を提供するステップと
を含む、方法。

(項目15)

式V-vの化合物、

【化297】

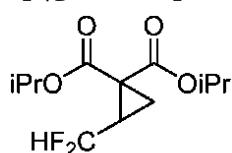


V-v

またはその共結晶、もしくは塩を調製する方法であって、

a) 式A-bの化合物、

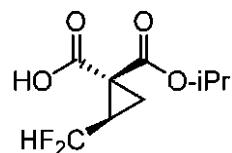
【化298】



A-b

またはその共結晶、もしくは塩を加水分解して、式A-cの化合物、

【化299】

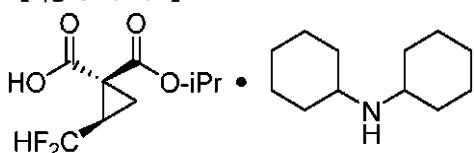


A-c

またはその共結晶、もしくは塩を提供するステップと、

b) 該式A-cの化合物またはその共結晶、もしくは塩を、ジシクロヘキシリアミンと接
触させて、式A-gの化合物、

【化300】

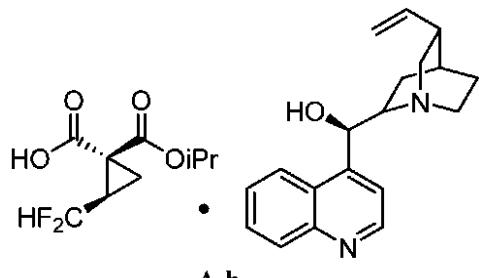


A-g

またはその共結晶、もしくは塩を提供するステップと、

c) A - g またはその共結晶、もしくは塩を、シンコニジンと接触させて、式 A - h の化合物、

【化301】

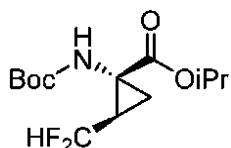


A-h

またはその共結晶、もしくは塩を提供するステップと、

d) A - h またはその共結晶、もしくは塩を、t e r t - ブタノールの存在下でクルチウス転位に付して、式 A - i の化合物、

【化302】



A-i

またはその共結晶、もしくは塩を提供するステップと、

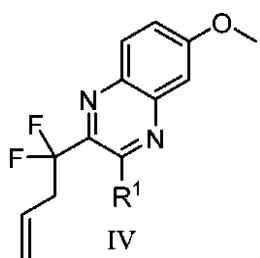
e) A - i またはその共結晶、もしくは塩を加水分解して、V - v またはまたはその共結晶、もしくは塩を提供するステップと

を含む、方法。

(項目16)

式IVの化合物、

【化303】

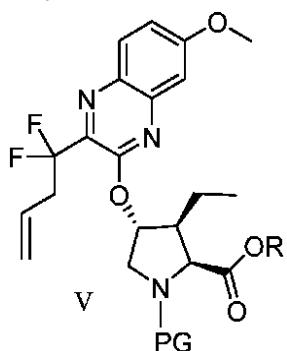


またはその共結晶、もしくは塩(式中、R¹は、脱離基である)。

(項目17)

式Vの化合物、

【化304】

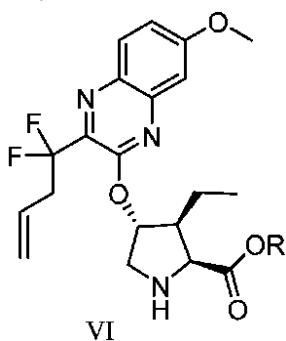


またはその共結晶、もしくは塩（式中、Rは、C_{1～6}アルキルであり、PGは、保護基である）。

（項目18）

式V Iの化合物、

【化305】

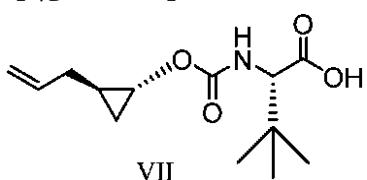


またはその共結晶、もしくは塩（式中、Rは、C_{1～6}アルキルである）。

（項目19）

式V I Iの化合物、

【化306】

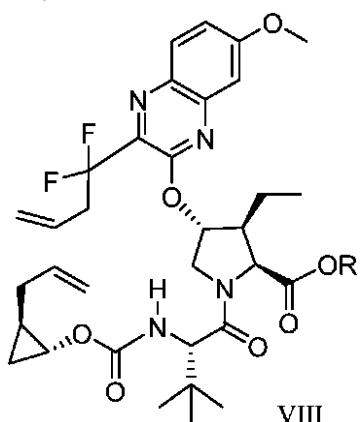


またはその共結晶、もしくは塩。

（項目20）

式V I I Iの化合物、

【化307】

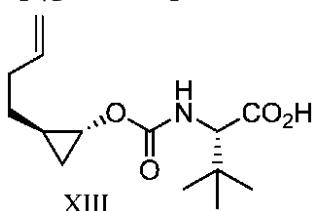


またはその共結晶、もしくは塩（式中、Rは、C₁～₆アルキルである）。

（項目21）

式XIIIの化合物、

【化308】

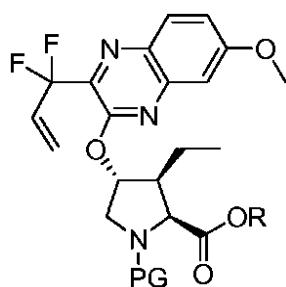


またはその共結晶、もしくは塩。

（項目22）

式XIVの化合物、

【化309】

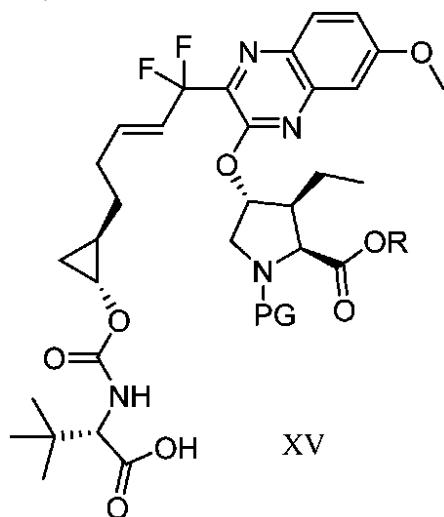


またはその共結晶、もしくは塩（式中、Rは、C₁～₆アルキルである）。

（項目23）

式XVの化合物、

【化310】

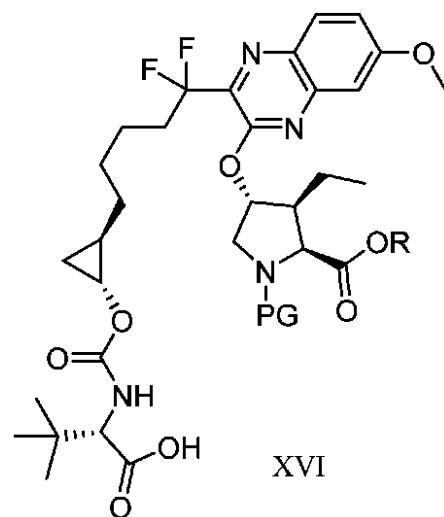


またはその共結晶、もしくは塩（式中、Rは、C₁～₆アルキルであり、PGは、保護基である）。

（項目24）

式XV Iの化合物、

【化311】

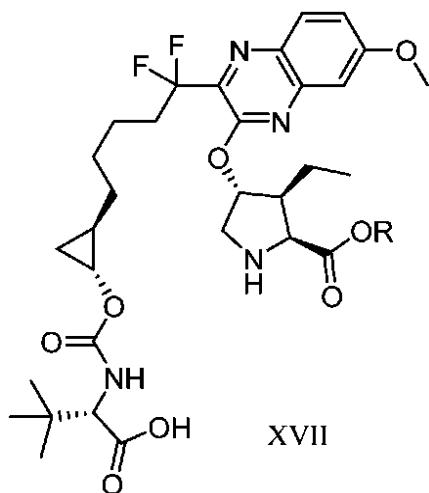


またはその共結晶、もしくは塩（式中、Rは、C₁～₆アルキルであり、PGは、保護基である）。

（項目25）

式XV I Iの化合物、

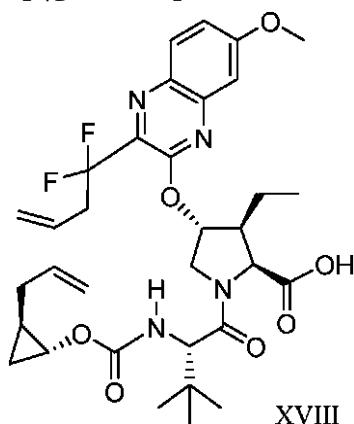
【化312】



またはその共結晶、もしくは塩（式中、Rは、C₁～₆アルキルである）。
 （項目26）

式XVIIIの化合物、

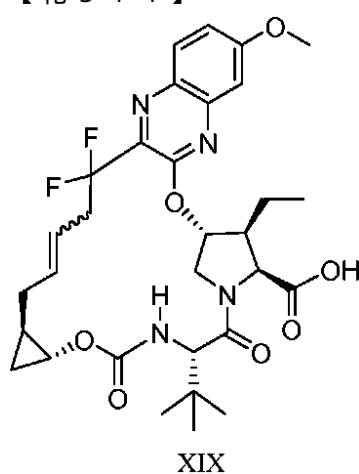
【化313】

またはその共結晶、もしくは塩。

（項目27）

式XIXの化合物、

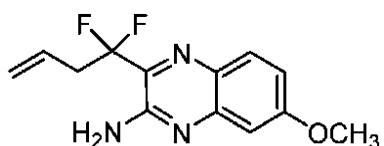
【化314】



またはその共結晶、もしくは塩。
 （項目28）

式 I V - d の化合物、

【化 3 1 5】



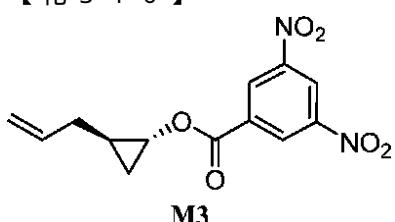
IV-d

またはその共結晶、もしくは塩。

(項目 2 9)

式 M 3 の化合物、

【化 3 1 6】



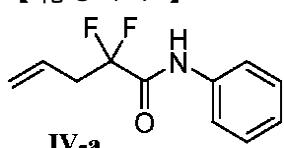
M3

またはその共結晶、もしくは塩。

(項目 30)

式 I V - a の化合物、

【化 3.1.7】



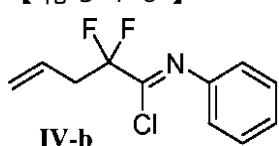
IV-a

またはその共結晶、もしくは塩。

(項目 3 1)

式 IV - b の化合物、

【化 3 1 8】



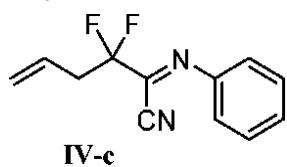
IV-b

またはその共結晶、もしくは塩。

(項目 3 2)

式 I V - c の化合物、

【化 3 1 9】



IV-**c**

またはその共結晶、もしくは塩。