

【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 0 7 K 5/12 (2006.01)

A 6 1 K 38/00 (2006.01)

C 0 7 D 241/44 (2006.01)

A 6 1 P 31/14 (2006.01)

A 6 1 P 1/16 (2006.01)

C 0 7 C 231/12 (2006.01)

C 0 7 C 271/34 (2006.01)

C 0 7 C 205/57 (2006.01)

C 0 7 C 255/61 (2006.01)

C 0 7 C 233/07 (2006.01)

C 0 7 C 233/06 (2006.01)

C 0 7 C 251/12 (2006.01)

C 0 7 D 453/04 (2006.01)

C 0 7 B 61/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 K 5/12

A 6 1 K 37/02

C 0 7 D 241/44 C S P

A 6 1 P 31/14

A 6 1 P 1/16

C 0 7 C 231/12

C 0 7 C 271/34

C 0 7 C 205/57

C 0 7 C 255/61

C 0 7 C 233/07

C 0 7 C 233/06

C 0 7 C 251/12

C 0 7 D 453/04

C 0 7 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

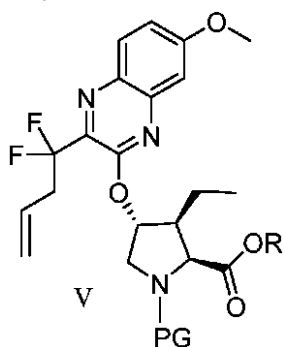
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

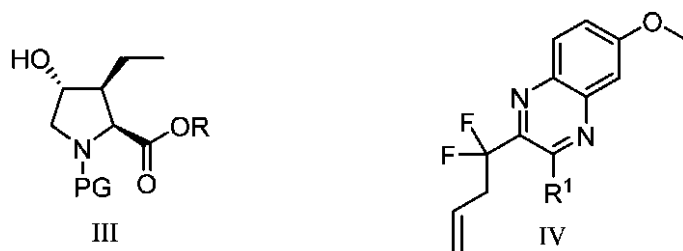
【請求項 1】

式 V の化合物、

【化 2 4 2】



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 2 4 3】

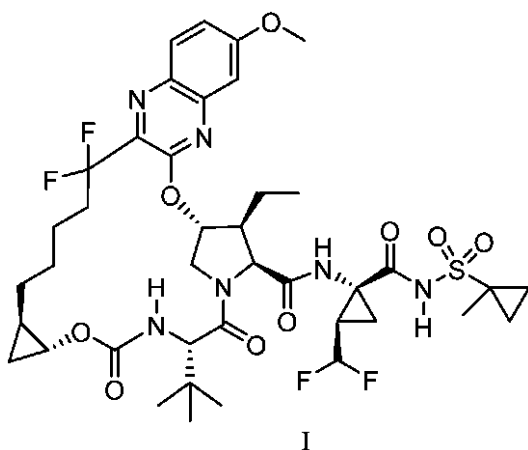


と、O - アリール化条件下で接触させて、該式 V の化合物またはその塩を提供するステップを含み、
式中、R は、C₁ ~ 6 アルキルであり、PG は、保護基であり、R¹ は、脱離基である、
方法。

【請求項 2】

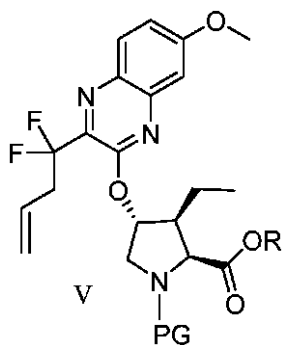
式 I の化合物、

【化 2 5 1】



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、

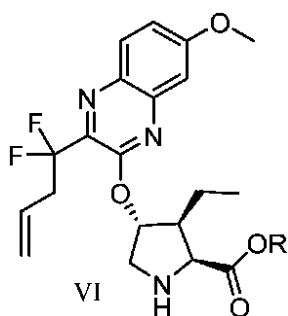
【化 2 5 3】



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、

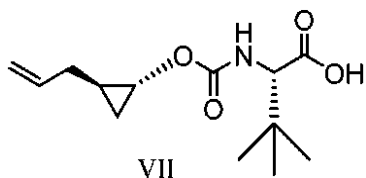
【化 2 5 4】



またはその塩を提供するステップと、

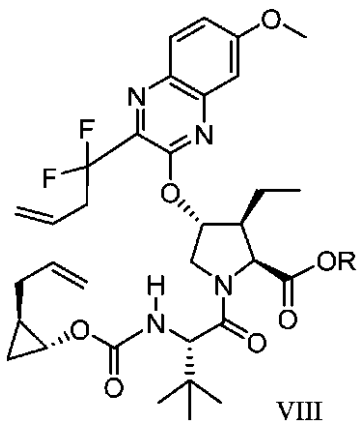
c) 該式 V I の化合物またはその塩を、式 V I I の化合物、

【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、

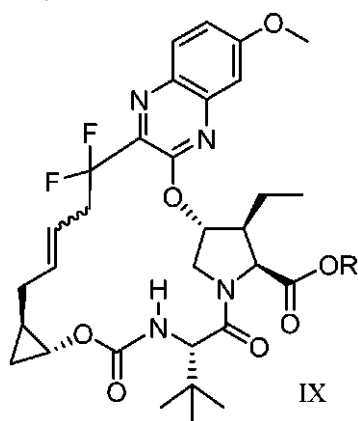
【化 2 5 6】



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、

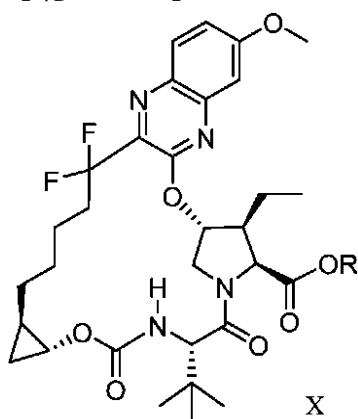
【化 2 5 7】



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、

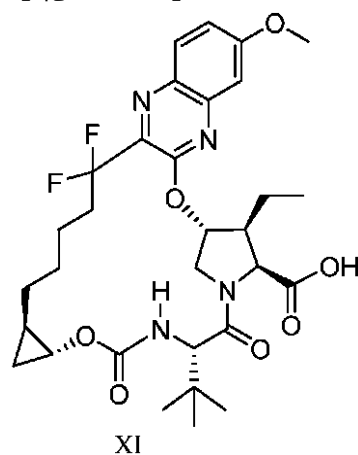
【化 2 5 8】



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、

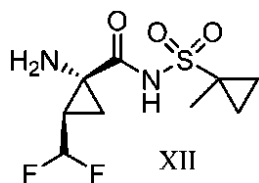
【化 2 5 9】



またはその塩を提供するステップと、

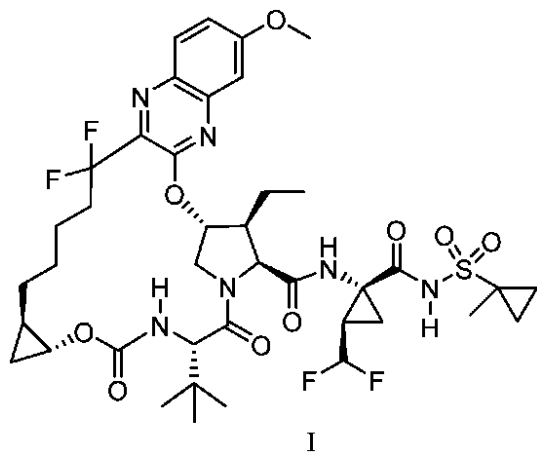
g) 該式 XI の化合物またはその塩を、式 XII の化合物、

【化 2 6 0】



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 2 6 1】



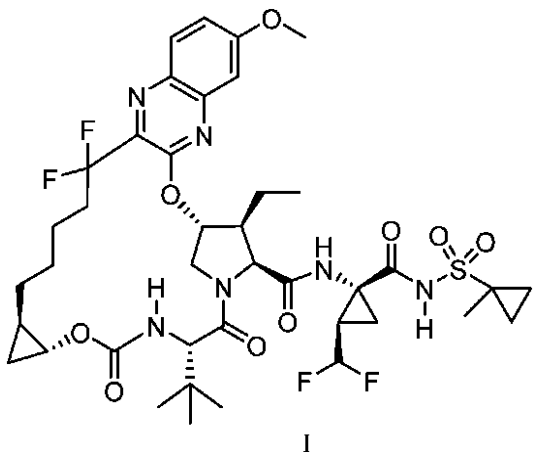
またはその薬学的に許容される塩を提供するステップと
を含み、

式中、R は、 $C_{1 \sim 6}$ 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 2 6 8】



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、

COC1=CC=C2C(=C1)N=C(C(F)(F)C=C)C(=O)N2C3CC[C@H](C3)C(=O)OR

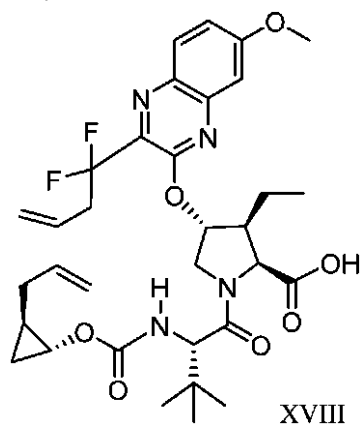
b) 該式 V の化合物またはその塩を、酸と、N - 脱保護条件下で接触させて、式 V I の化合物、

VI

VIII

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

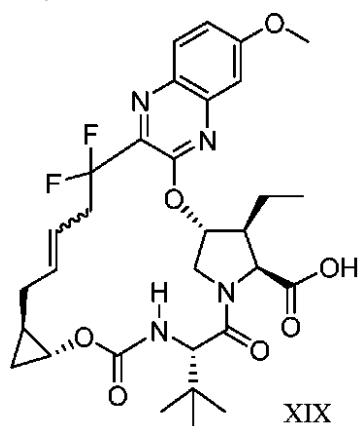
【化 2 7 4】



またはその塩を提供するステップと、

e) 該式 X V I I I 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 X I X の化合物、

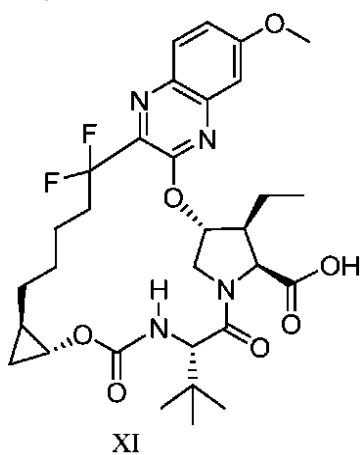
【化 2 7 5】



またはその塩を提供するステップと、

f) 該式 X I X の化合物を、触媒の存在下で水素化して、式 X I の化合物、

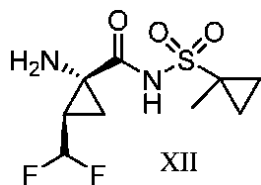
【化 2 7 6】



またはその塩を提供するステップと、

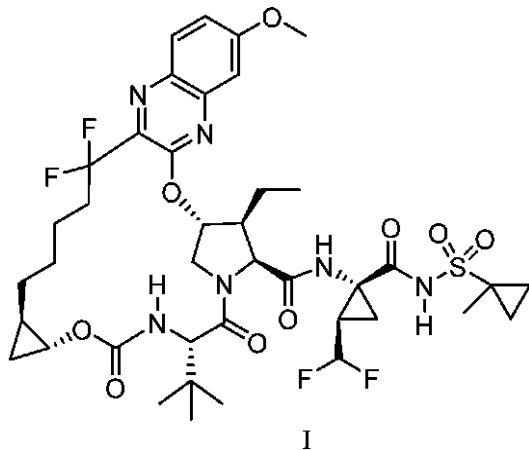
g) 該式 X I の化合物またはその塩を、式 X I I の化合物、

【化 2 7 7】



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 2 7 8】



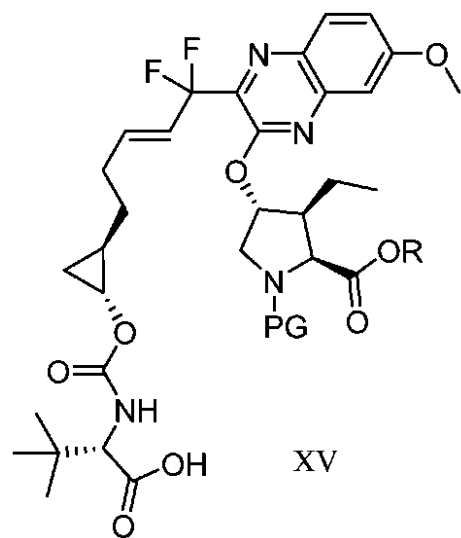
またはその薬学的に許容される塩を提供するステップと
を含み、

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】

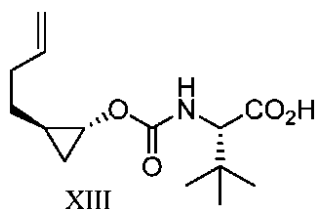
式 X V の化合物、

【化 2 7 9】



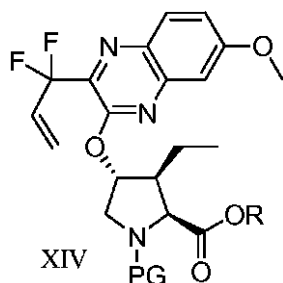
またはその塩を調製する方法であって、式 X I I I の化合物、

【化 2 8 0】



またはその塩を、式 X I V の化合物、

【化 2 8 1】

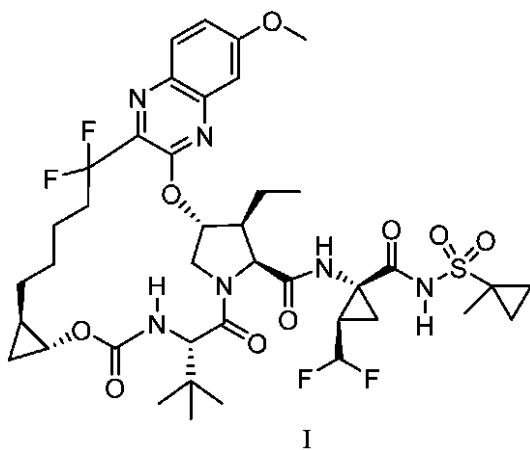


またはその塩と、クロスメタセシス条件下で接触させて、該式 X V の化合物またはその塩
を提供するステップを含み、
 式中、R は、 C_{1-6} アルキルであり、P G は、保護基である、
 方法。

【請求項 5】

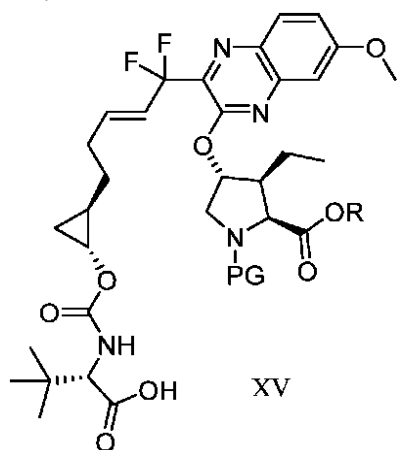
式 I の化合物、

【化 2 8 7】



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 X V の化合物、

【化 2 9 0】

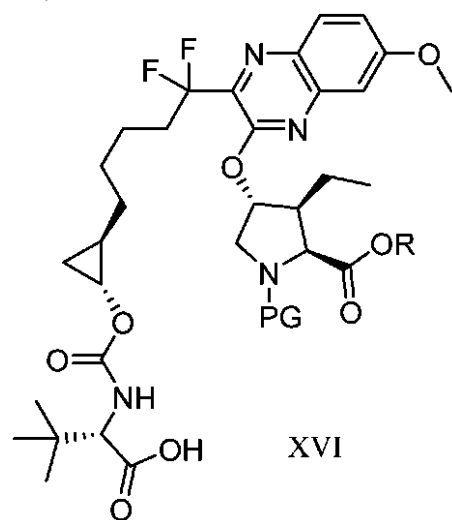


XV

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 2 9 1】

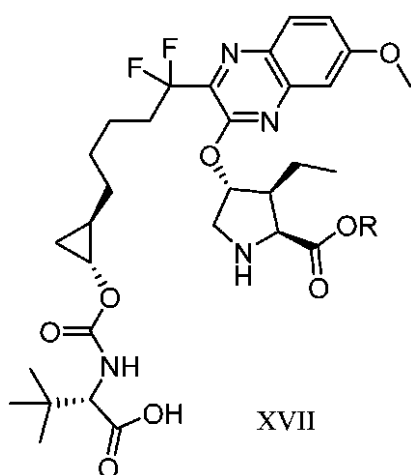


XVI

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 2 9 2】

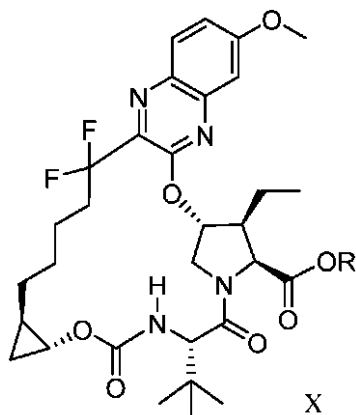


XVII

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、

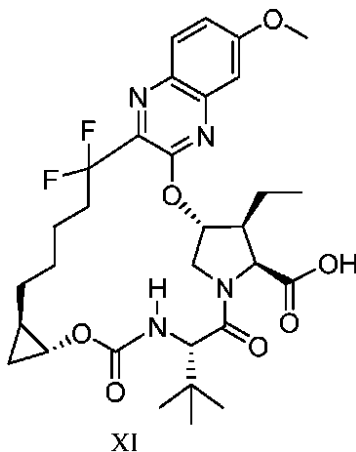
【化 2 9 3】



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、

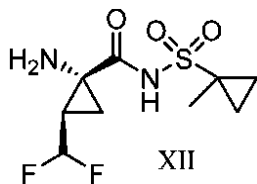
【化 2 9 4】



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】



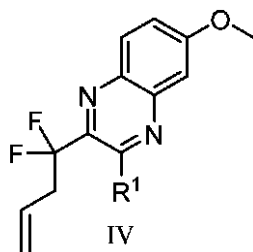
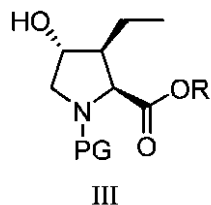
またはその塩と、アミドカップリング条件下で接触させて、該式 I の化合物、

CC[C@H]1N[C@@H](C(=O)N[C@H]2C[C@H](C(F)(F)F)C2)C(=O)N[C@@H]1C(=O)N[C@@H](C(C)(C)C)C(=O)O[C@H]3C[C@H](C(=O)N[C@@H]4C[C@H](C(=O)NS(=O)(=O)C5(C)CC5)C[C@H](F)C4)C[C@H](C(F)(F)F)CC(F)(F)C(=Nc6cc(OC)ccn6)O1COC1=CC=C(N2C(=O)N(C2C[C@H]3C[C@@H](C3)C(=O)OR)C(=O)C(F)(F)C=C)C=C1

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、
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 2 4 3】

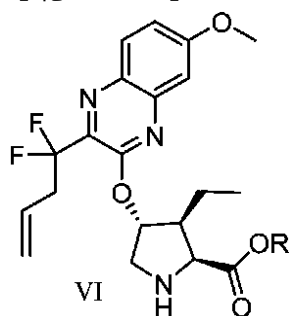


と、O - アリール化条件下で接触させて、該式 V の化合物またはその共結晶、もしくは塩（式中、R は、C₁ ~ 6 アルキルであり、PG は、保護基であり、R¹ は、脱離基である）を提供するステップを含む、方法。

（項目 2）

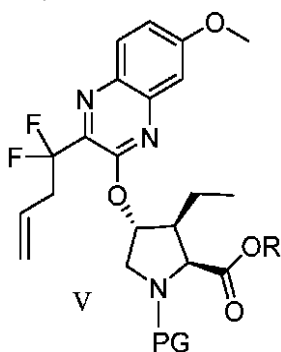
式 V I の化合物、

【化 2 4 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 V の化合物、

【化 2 4 5】

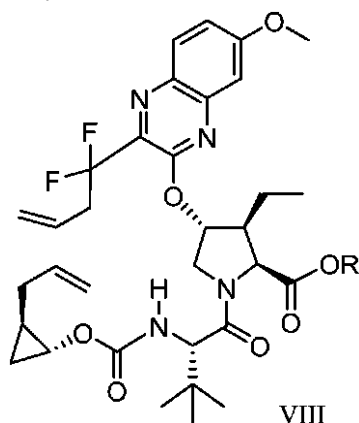


またはその共結晶、もしくは塩を、N - 脱保護条件に付して、該式 V I の化合物またはその共結晶、もしくは塩（式中、R は、C₁ ~ 6 アルキルであり、PG は、保護基である）を提供するステップを含む、方法。

（項目 3）

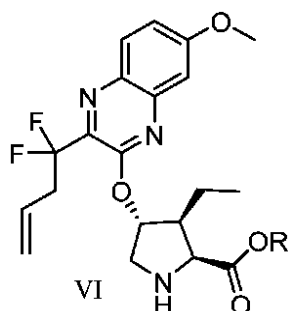
式 V I I I の化合物、

【化 2 4 6】



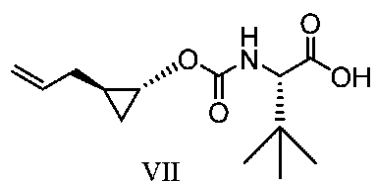
またはその共結晶、もしくは塩を調製する方法であって、
式 V I の化合物、

【化 2 4 7】



またはその共結晶、もしくは塩を、
式 V I I の化合物、

【化 2 4 8】

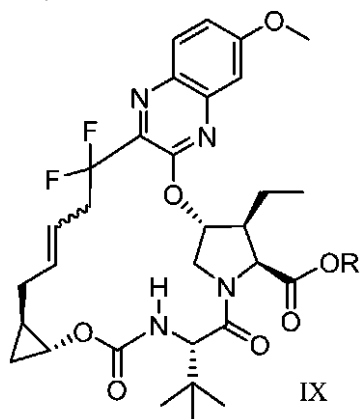


またはその共結晶、もしくは塩と、アミドカップリング条件下で接触させて、該式 V I I
I の化合物またはその共結晶、もしくは塩（式中、R は、C₁ - 6 アルキルである）を提
供するステップを含む、方法。

（項目 4）

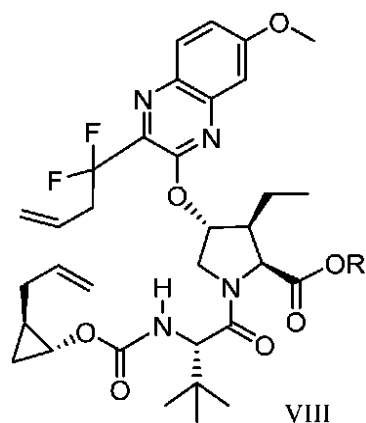
式 I X の化合物、

【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】

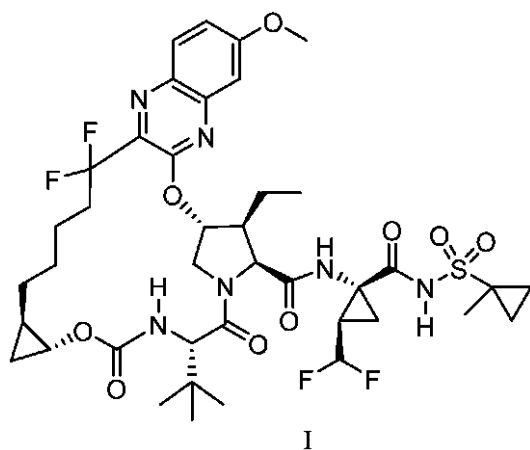


またはその共結晶、もしくは塩の閉環メタセシスを実施して、該式 I X の化合物またはその共結晶、もしくは塩（式中、R は、 $C_1 \sim 6$ アルキルである）を提供するステップを含む、方法。

（項目 5）

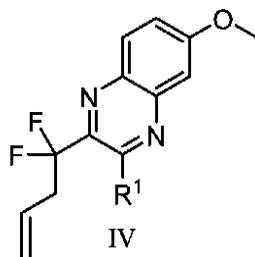
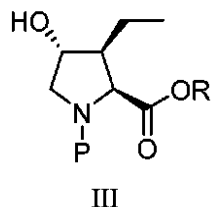
式 I の化合物、

【化 2 5 1】



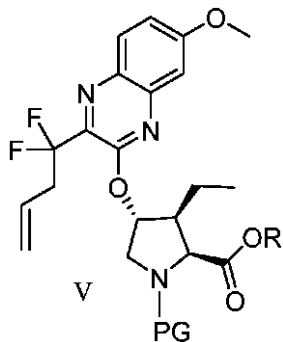
またはその共結晶、もしくは薬学的に許容される塩を調製する方法であって、
a) 式 I I I の化合物またはその共結晶、もしくは塩を、式 I V の化合物

【化 2 5 2】



と、O - アリール化条件下で接触させて、式 V の化合物、

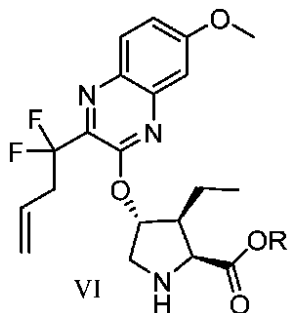
【化 2 5 3】



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 V I の化合物、

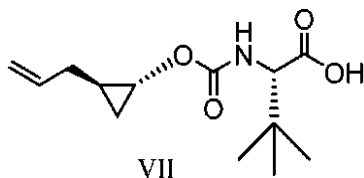
【化 2 5 4】



またはその共結晶、もしくは塩を提供するステップと、

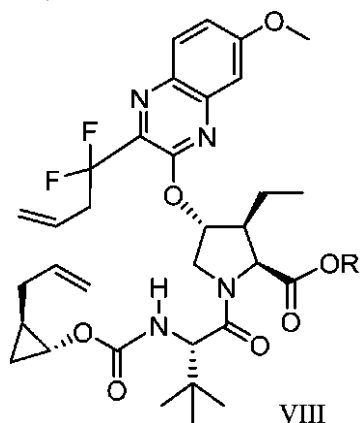
c) 該式 V I の化合物またはその共結晶、もしくは塩を、式 V I I の化合物、

【化 2 5 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、式 V I I I の化合物、

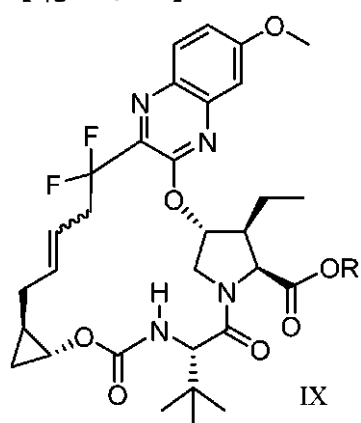
【化 2 5 6】



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 V I I I 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 I X の化合物、

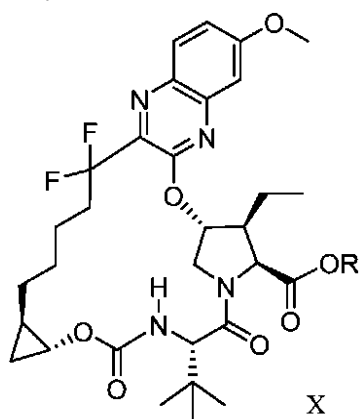
【化 2 5 7】



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 I X 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、

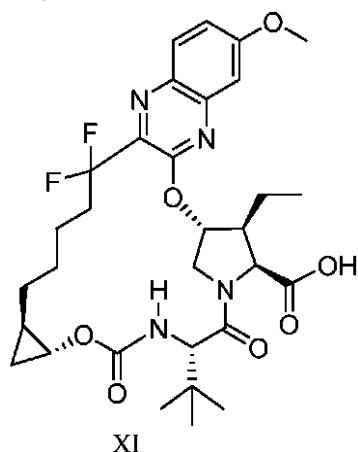
【化 2 5 8】



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 X I の化合物、

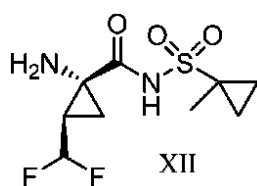
【化 2 5 9】



またはその共結晶、もしくは塩を提供するステップと、

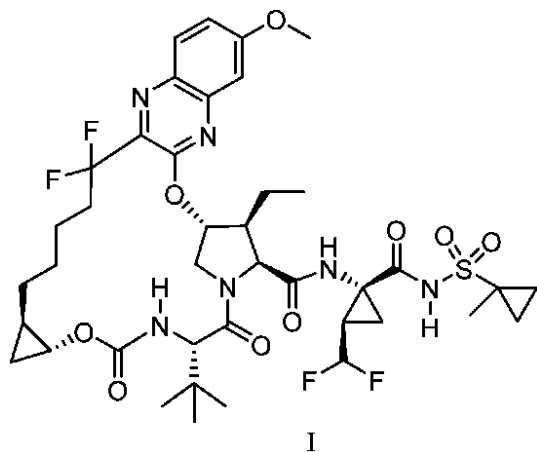
g) 該式 X I の化合物またはその共結晶、もしくは塩を、式 X I I の化合物、

【化 2 6 0】



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 2 6 1】

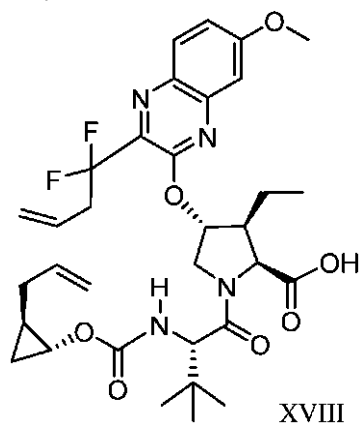


またはその共結晶、もしくは薬学的に許容される塩（式中、R は、C₁ ~ 6 アルキルであり、PG は、保護基であり、R¹ は、脱離基である）を提供するステップとを含む、方法。

（項目 6）

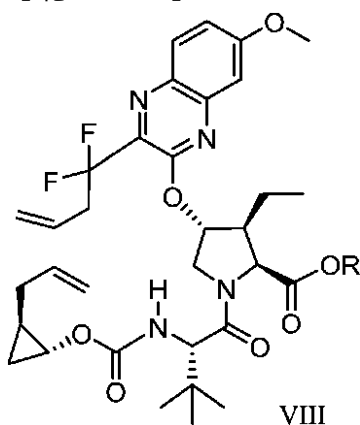
式 X V I I I の化合物、

【化 2 6 2】



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 6 3】

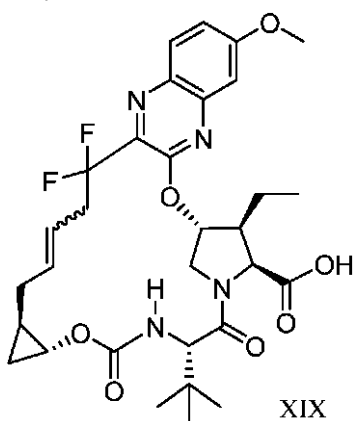


またはその共結晶、もしくは塩を加水分解して、該式 X V I I I の化合物またはその共結晶、もしくは塩（式中、R は、C₁ ~ 6 アルキルである）を提供するステップを含む、方法。

（項目 7）

式 X I X の化合物、

【化 2 6 4】

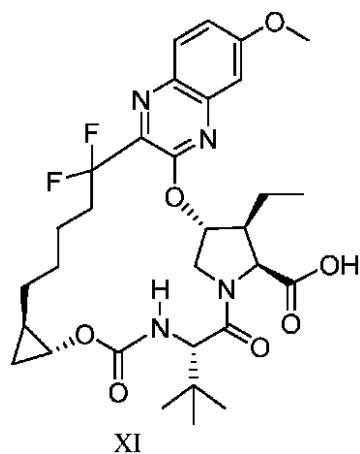


またはその共結晶、もしくは塩を調製する方法であって、
前記式 X V I I I の化合物またはその共結晶、もしくは塩の閉環メタセシスを、触媒の存在下で実施して、該式 X I X の化合物を提供するステップを含む、方法。

（項目 8）

式 X I の化合物、

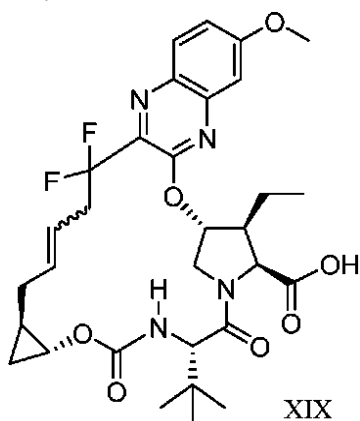
【化 2 6 5】



またはその共結晶、もしくは塩を調製する方法であって、

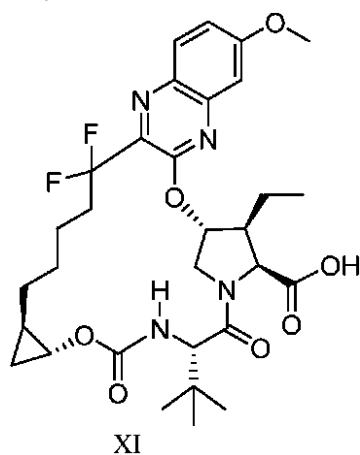
式 X I X の化合物、

【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】

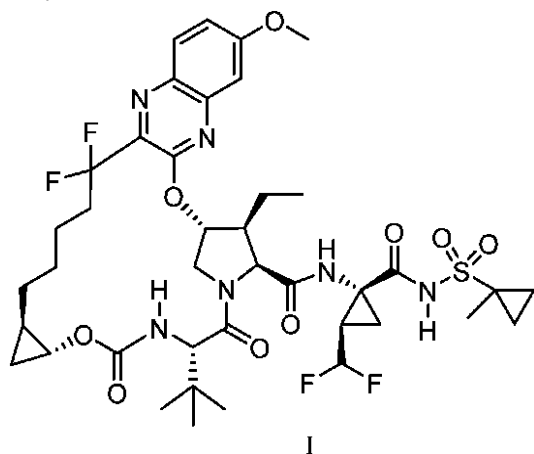


またはその共結晶、もしくは塩を提供するステップを含む、方法。

(項目 9)

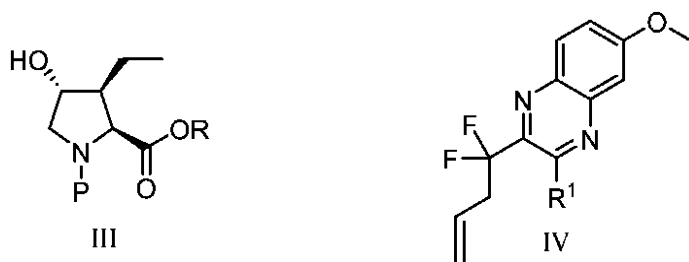
式 I の化合物、

【化 2 6 8】



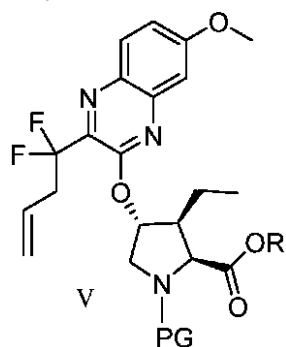
またはその共結晶、もしくは薬学的に許容される塩を調製する方法であって、
a) 式 I I I の化合物またはその共結晶、もしくは塩を、式 I V の化合物

【化 2 6 9】



と、O - アリール化条件下で接触させて、式 V の化合物、

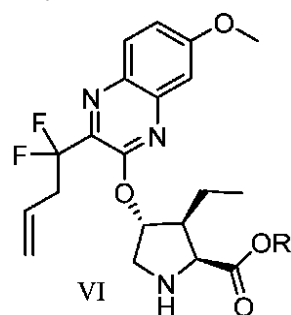
【化 2 7 0】



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 V I の化合物、

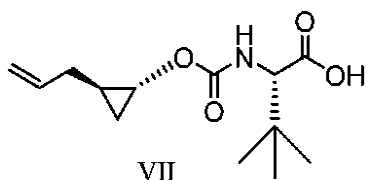
【化 2 7 1】



またはその共結晶、もしくは塩を提供するステップと、

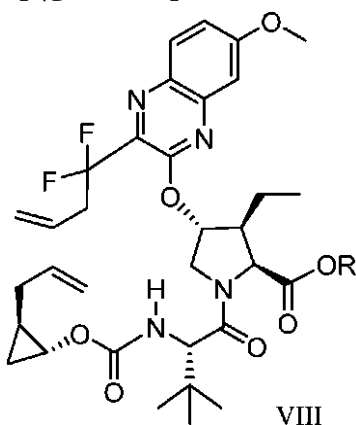
c) 該式 V I の化合物またはその共結晶、もしくは塩を、式 V I I の化合物、

【化 2 7 2】



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 V I I I の化合物、

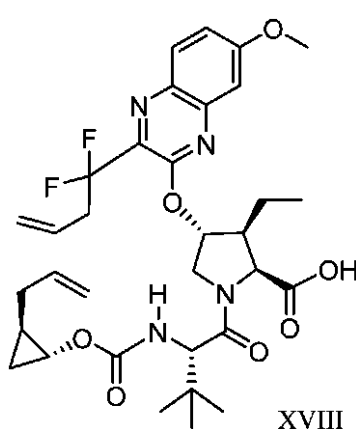
【化 2 7 3】



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 V I I I 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 V I I I の化合物、

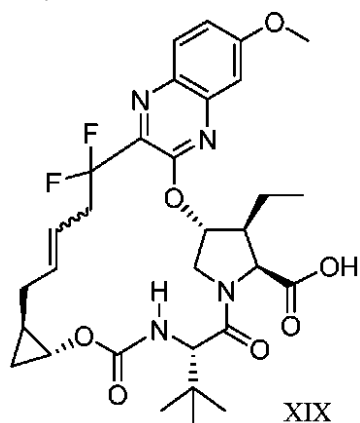
【化 2 7 4】



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 X V I I I 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 X I X の化合物、

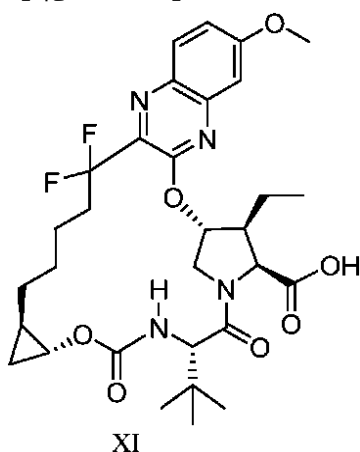
【化 2 7 5】



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 X の化合物を、触媒の存在下で水素化して、式 X I の化合物、

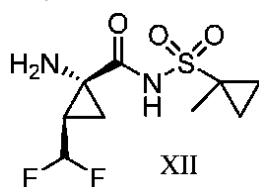
【化 2 7 6】



またはその共結晶、もしくは塩を提供するステップと、

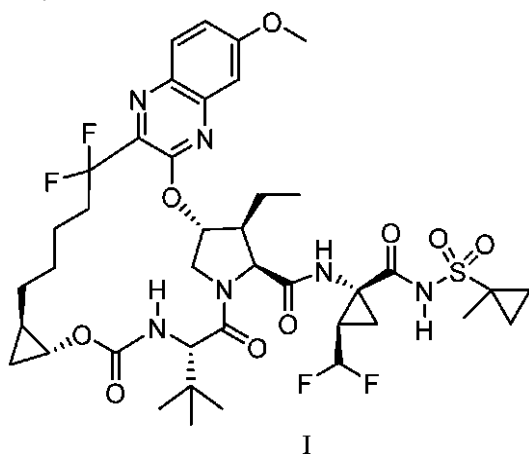
g) 該式 X I の化合物またはその共結晶、もしくは塩を、式 X I I の化合物、

【化 2 7 7】



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 2 7 8】

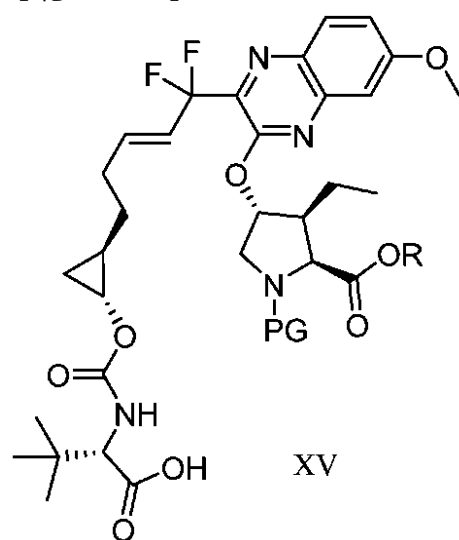


またはその共結晶、もしくは薬学的に許容される塩（式中、R は、 C_{1-6} アルキルであり、PG は、保護基であり、 R^1 は、脱離基である）を提供するステップとを含む、方法。

（項目 10）

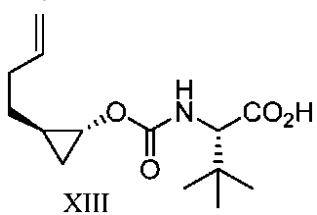
式 XV の化合物、

【化 2 7 9】



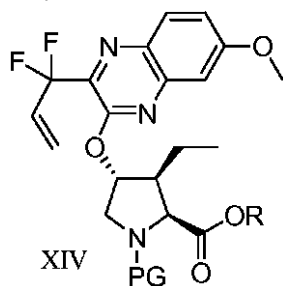
またはその共結晶、もしくは塩を調製する方法であって、式 XIIII の化合物、

【化 2 8 0】



またはその共結晶、もしくは塩を、式 XIV の化合物、

【化 2 8 1】

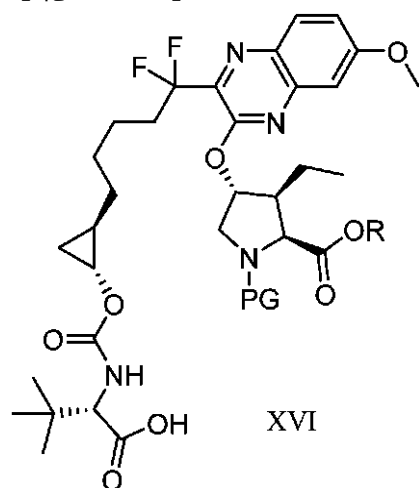


またはその共結晶、もしくは塩と、クロスメタセシス条件下で接触させて、該式 X V の化合物またはその共結晶、もしくは塩（式中、R は、 C_{1-6} アルキルであり、P G は、保護基である）を提供するステップを含む、方法。

（項目 1 1）

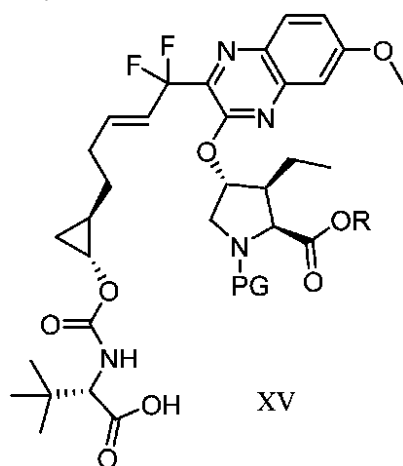
式 X V I の化合物、

【化 2 8 2】



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 X V の化合物、

【化 2 8 3】

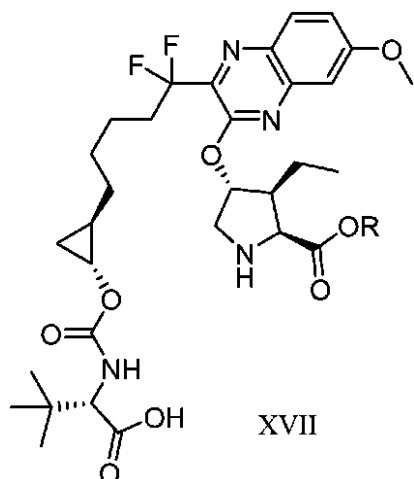


またはその共結晶、もしくは塩を、触媒の存在下で水素化して、該式 X V I の化合物またはその共結晶、もしくは塩（式中、R は、 C_{1-6} アルキルであり、P G は、保護基である）を提供するステップを含む、方法。

（項目 1 2）

式 X V I I の化合物、

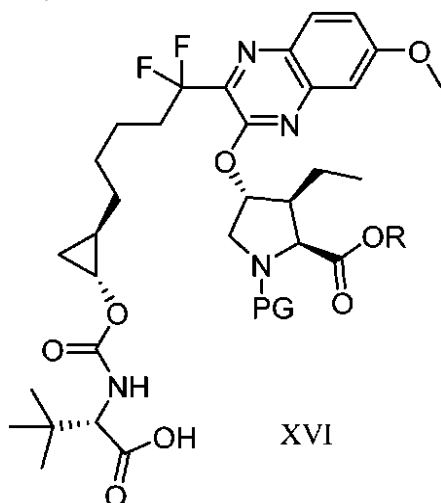
【化 2 8 4】



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】

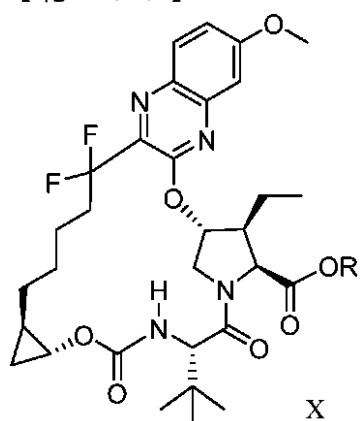


またはその共結晶、もしくは塩を、N - 脱保護条件に付して、該式 X V I I の化合物またはその共結晶、もしくは塩（式中、R は、C₁ ~ 6 アルキルであり、PG は、保護基である）を提供するステップを含む、方法。

（項目 1 3）

式 X の化合物、

【化 2 8 6】

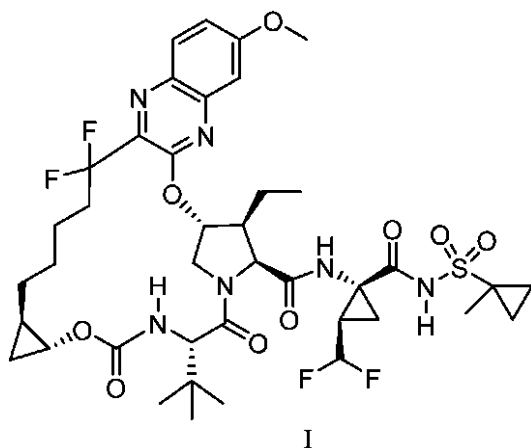


またはその共結晶、もしくは塩を調製する方法であって、
前記式 X V I I の化合物を、アミドカップリング剤と、ラクタム化条件下で接触させて、
該式 X の化合物またはその共結晶、もしくは塩（式中、R は、C₁ - 6 アルキルである）
を得るステップを含む、方法。

（項目 1 4）

式 I の化合物、

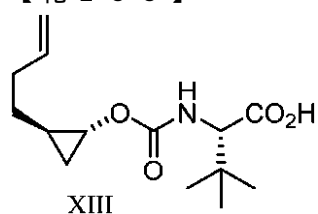
【化 2 8 7】



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 X I I I の化合物、

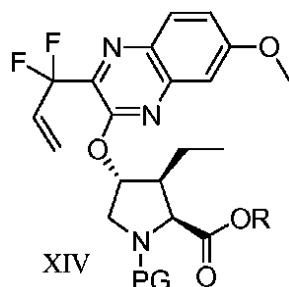
【化 2 8 8】



またはその共結晶、もしくは塩を、

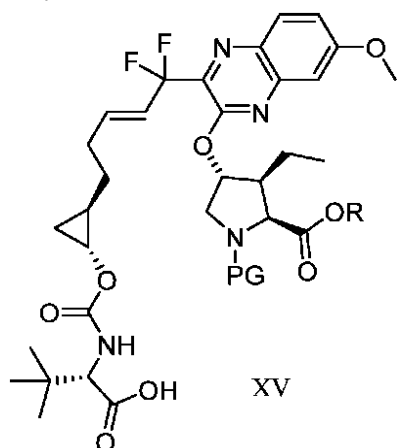
式 X I V の化合物、

【化 2 8 9】



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

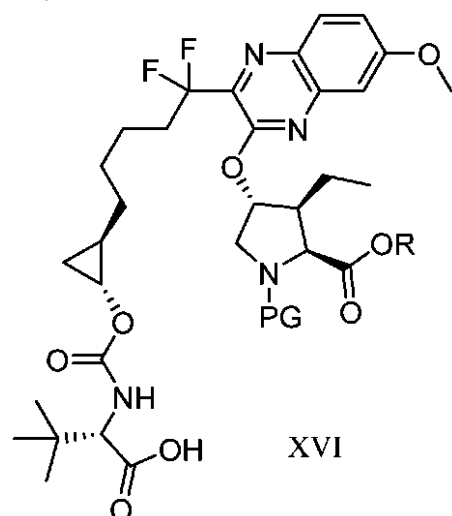
【化 2 9 0】



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 X V 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 V I の化合物、

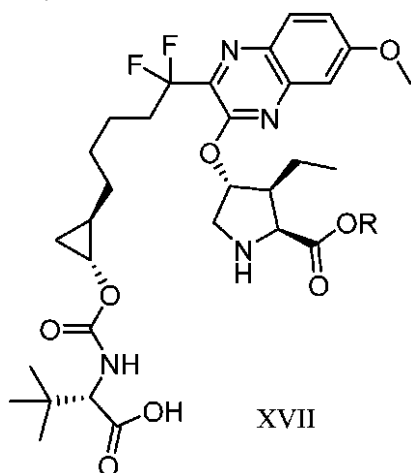
【化 2 9 1】



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 X V I 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 X V I I の化合物、

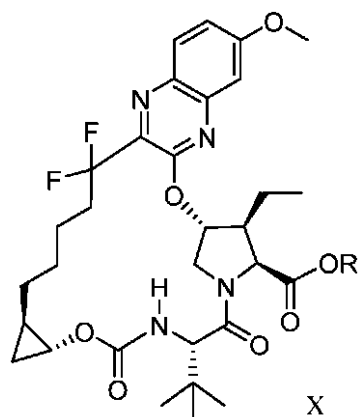
【化 2 9 2】



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、

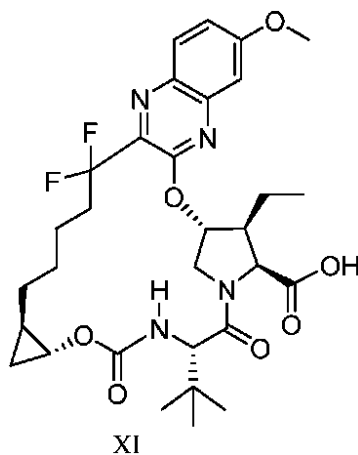
【化 2 9 3】



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、

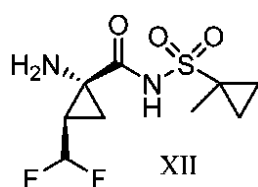
【化 2 9 4】



またはその共結晶、もしくは塩を提供するステップと、

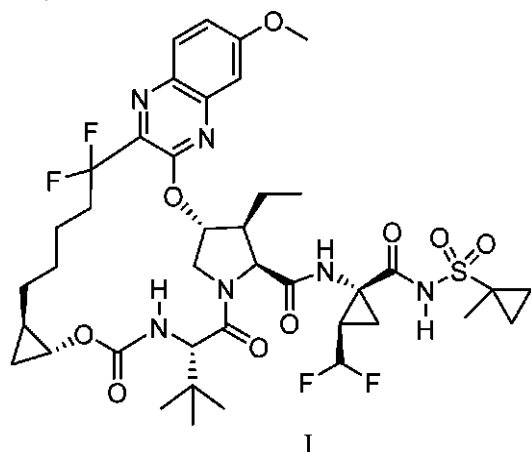
f) 該式 X I の化合物またはその共結晶、もしくは塩を、式 X I I の化合物、

【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 2 9 6】

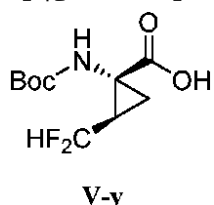


またはその共結晶、もしくは（式中、R は、 $C_1 - 6$ アルキルであり、PG は、保護基である）を提供するステップとを含む、方法。

（項目 1 5）

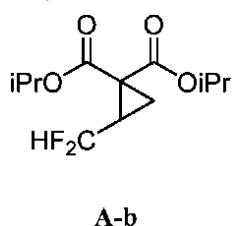
式 V - v の化合物、

【化 2 9 7】



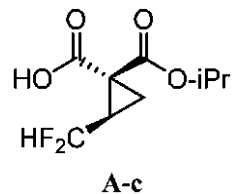
またはその共結晶、もしくは塩を調製する方法であって、
a) 式 A - b の化合物、

【化 2 9 8】



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、

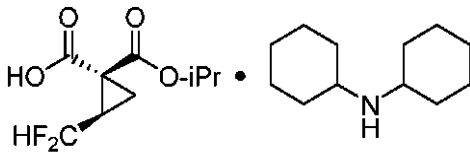
【化 2 9 9】



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、ジシクロヘキシルアミンと接触させて、式 A - g の化合物、

【化 3 0 0】

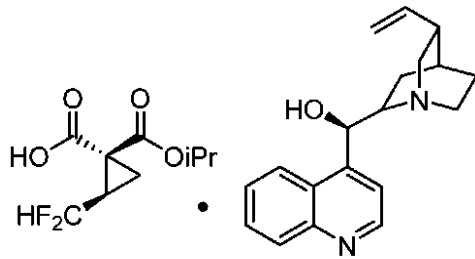


A-g

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 3 0 1】

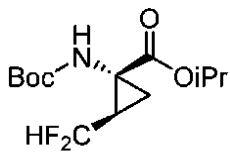


A-h

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、tert - 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 3 0 2】



A-i

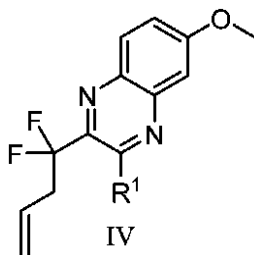
またはその共結晶、もしくは塩を提供するステップと、

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 1 6)

式 I V の化合物、

【化 3 0 3】



IV

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 1 7)

式 V の化合物、

COC1=CC=C2C(=C1)N=C(C(F)(F)C=C)C(=O)N2[C@H]3CC[C@@H](C)[C@H]3N(C)C(=O)OR

式 V I の化合物、

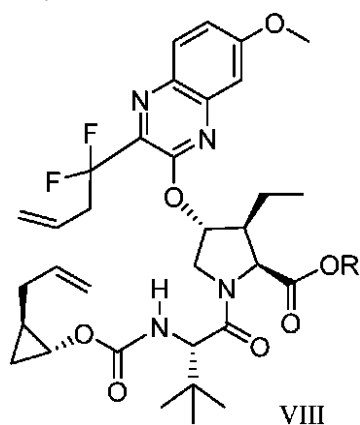
VI

式 V I I の化合物、

VII

式 V I I I の化合物、

【化 3 0 7】

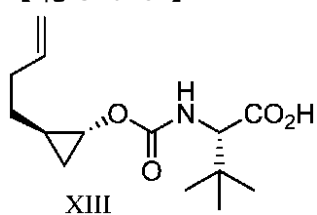


またはその共結晶、もしくは塩（式中、R は、 $C_1 \sim 6$ アルキルである）。

（項目 2 1）

式 X I I I の化合物、

【化 3 0 8】

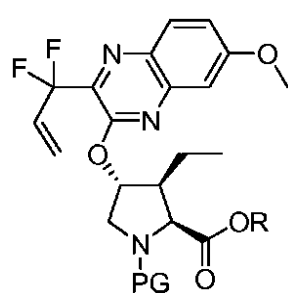


またはその共結晶、もしくは塩。

（項目 2 2）

式 X I V の化合物、

【化 3 0 9】

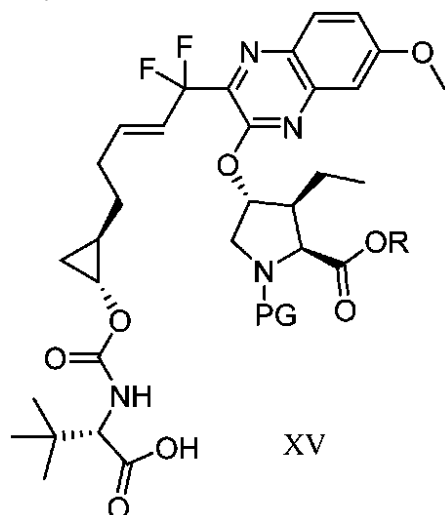


またはその共結晶、もしくは塩（式中、R は、 $C_1 \sim 6$ アルキルである）。

（項目 2 3）

式 X V の化合物、

【化 3 1 0】

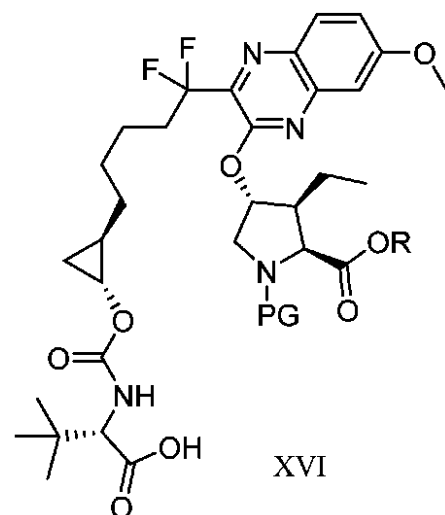


またはその共結晶、もしくは塩（式中、R は、 $C_1 \sim 6$ アルキルであり、PG は、保護基である）。

（項目 2 4）

式 X V I の化合物、

【化 3 1 1】

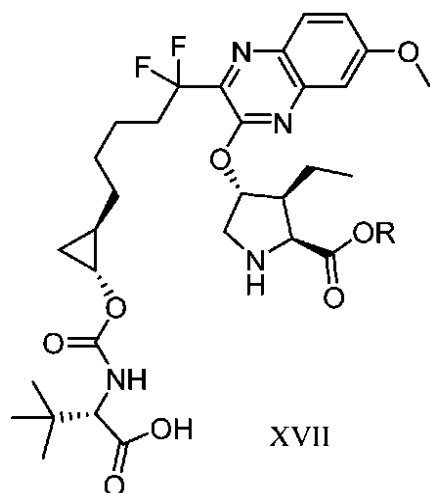


またはその共結晶、もしくは塩（式中、R は、 $C_1 \sim 6$ アルキルであり、PG は、保護基である）。

（項目 2 5）

式 X V I I の化合物、

【化 3 1 2】

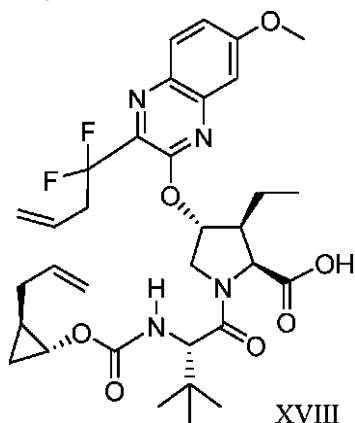


またはその共結晶、もしくは塩（式中、R は、 $C_1 \sim 6$ アルキルである）。

（項目 2 6）

式 XVIII の化合物、

【化 3 1 3】

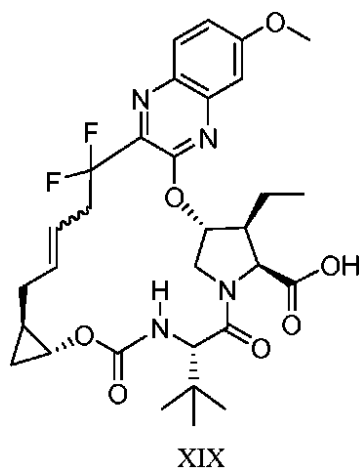


またはその共結晶、もしくは塩。

（項目 2 7）

式 XIX の化合物、

【化 3 1 4】

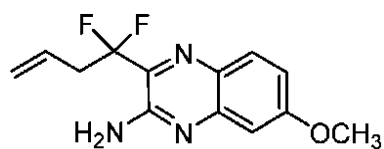


またはその共結晶、もしくは塩。

（項目 2 8）

式 I V - d の化合物、

【化 3 1 5】



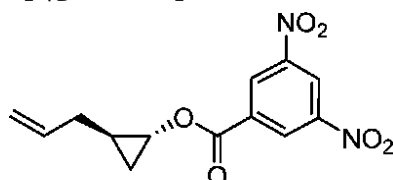
IV-d

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】



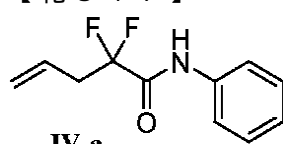
M3

またはその共結晶、もしくは塩。

(項目 3 0)

式 I V - a の化合物、

【化 3 1 7】



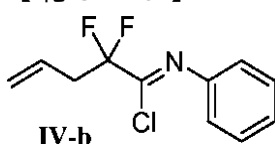
IV-a

またはその共結晶、もしくは塩。

(項目 3 1)

式 I V - b の化合物、

【化 3 1 8】



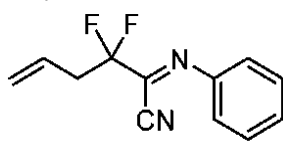
IV-b

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。