

【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】令和 6 年 5 月 10 日(2024.5.10)

【国際公開番号】WO2021/241611
 【出願番号】特願 2022-526599(P2022-526599)
 【国際特許分類】

C 0 7 D 4 7 1 / 0 4 (2 0 0 6 . 0 1)

【 F I 】

C 0 7 D 4 7 1 / 0 4 1 1 3

10

C 0 7 D 4 7 1 / 0 4 C S P

C 0 7 D 4 7 1 / 0 4 Z N A

【手続補正書】

【提出日】令和 6 年 4 月 24 日(2024.4.24)

【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】

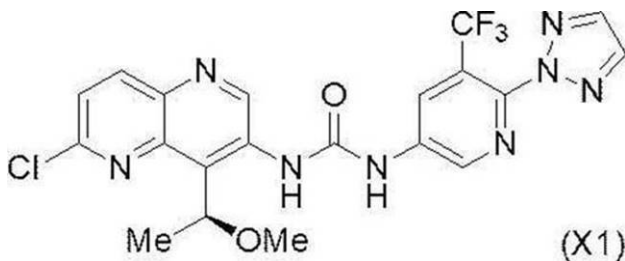
20

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

以下の式 (X 1) :

【化 1】



30

で表される化合物 (化合物 (X 1)) またはその塩を、単離および / または精製する工程を含むことを特徴とする、化合物 (X 1) またはその塩の製造方法。

【請求項 2】

単離および / または精製が、濃縮、晶出、再結晶、蒸留、溶媒抽出、分溜、およびクロマトグラフィーから選択される 1 以上の分離手段による単離および / または精製を含む、請求項 1 に記載の化合物 (X 1) またはその塩の製造方法。

【請求項 3】

光学純度が 99% ee 以上である、化合物 (X 1) またはその塩を得る工程を含むことを特徴とする、化合物 (X 1) またはその塩の製造方法。

40

【請求項 4】

前記光学純度が 99.1% ee 以上であることを特徴とする、請求項 3 に記載の化合物 (X 1) またはその塩の製造方法。

【請求項 5】

前記光学純度が 99.5% ee 以上であることを特徴とする、請求項 4 に記載の化合物 (X 1) またはその塩の製造方法。

【請求項 6】

(S) - 6 - クロロ - 4 - (1 - メトキシエチル) - 1 , 5 - ナフチリジン - 3 - アミン またはその塩を、6 - (2 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 2 - イル) - 5 - (トリフル

50

オロメチル)ピリジン-3-アミンまたはその塩と反応させることを特徴とする、化合物(X1)またはその塩の製造方法。

【請求項7】

(S)-6-クロロ-4-(1-メトキシエチル)-1,5-ナフチリジン-3-アミンまたはその塩を、フェニル6-(2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル)-5-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-アミノカーバメートまたはその塩と反応させることを特徴とする、化合物(X1)またはその塩の製造方法。

【請求項8】

式(B-1)：

【化2】



10

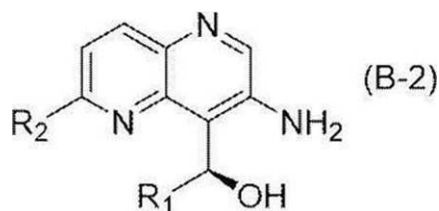
(式中、R₁はメチル基、および

R₂は、C₁-6アルキル基またはハロゲン原子を示す。)

で表される化合物(化合物(B-1))と光学活性な有機酸との塩を晶析することを特徴とする、式(B-2)：

20

【化3】



(式中、R₁およびR₂は、それぞれ前記と同義である。)

で表される化合物またはその塩の製造方法。

30

【請求項9】

1)式(B-1)：

【化4】



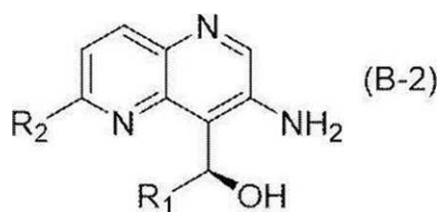
(式中、R₁はメチル基、および

R₂は、C₁-6アルキル基またはハロゲン原子を示す。)

で表される化合物(化合物(B-1))と光学活性な有機酸との塩を晶析して、式(B-2)：

40

【化5】



50

(式中、 R_1 および R_2 は、それぞれ前記と同義である。)
 で表される化合物(化合物(B-2))またはその塩を得て、
 2)得られた化合物(B-2)またはその塩を、アルキル化反応に付すことを特徴とする
 、式(C)：

【化6】



10

(式中、 R_1 および R_2 は、それぞれ前記と同義であり、および
 R_3 は、 C_{1-6} アルキル基を示す。)
 で表される化合物(化合物(C))またはその塩の製造方法。

【請求項10】

1)式(B-1)：

【化7】



20

(式中、 R_1 はメチル基、および
 R_2 は、 C_{1-6} アルキル基またはハロゲン原子を示す。)
 で表される化合物(化合物(B-1))と光学活性な有機酸との塩を晶析して、式(B-2)：

【化8】



30

(式中、 R_1 および R_2 は、それぞれ前記と同義である。)
 で表される化合物(化合物(B-2))またはその塩を得て、
 2)得られた化合物(B-2)またはその塩を、アルキル化反応に付して、式(C)：

【化9】



40

(式中、 R_1 および R_2 は、それぞれ前記と同義であり、および
 R_3 は、 C_{1-6} アルキル基を示す。)
 で表される化合物(化合物(C))またはその塩を得て、
 3)得られた化合物(C)またはその塩を、式(D)：

50

【化10】

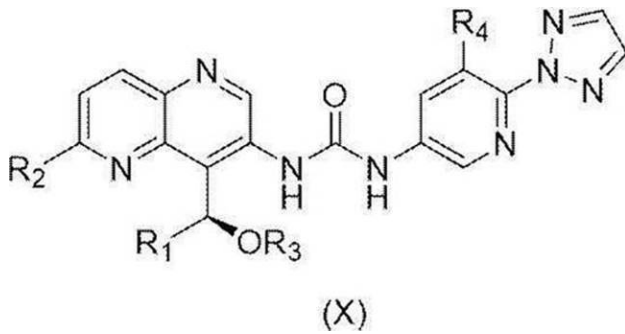


(式中、 R_4 は、ハロゲン原子で置換されていてもよい C_{1-6} アルキル基、および R_7 は、水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよい C_{1-6} アルコキシ基、またはニトロ基で置換されていてもよいアリールオキシカルボニル基をそれぞれ示す。)

10

で表される化合物(化合物(D))またはその塩と反応させることを特徴とする、式(X)

【化11】



20

(式中、 $R_1 \sim R_4$ は、それぞれ前記と同義である。)

で表される化合物(化合物(X))またはその塩の製造方法。

【請求項11】

1) 式(A) :

【化12】



30

(式中、 R_1 はメチル基、 R_2 は、 C_{1-6} アルキル基またはハロゲン原子、 R_5 および R_6 は、それぞれ独立して、水素原子またはアミノ保護基を示す。)

で表される化合物またはその塩を、1)カルボニル基の不斉還元反応、または、2)カルボニル基の不斉還元反応およびアミノ保護基の脱離反応、に付して、式(B-1) :

【化13】



40

(式中、 R_1 および R_2 はそれぞれ前記と同義である。)

で表される化合物(化合物(B-1))またはその塩を得て、

2) 得られた化合物(B-1)と光学活性な有機酸との塩を晶析することを特徴とする、

50

式 (B - 2) :

【化 1 4】



(式中、R₁およびR₂はそれぞれ前記と同義である。)

で表される化合物 (化合物 (B - 2)) またはその塩の製造方法。

10

【請求項 1 2】

1) 式 (A) :

【化 1 5】



(式中、R₁はメチル基、

20

R₂は、C₁-6アルキル基またはハロゲン原子、

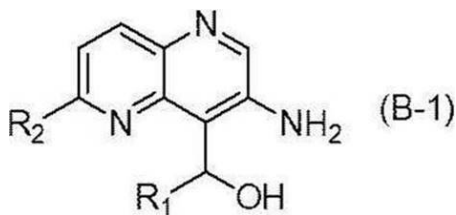
R₅およびR₆は、それぞれ独立して、水素原子またはアミノ保護基を示す。)

で表される化合物 (化合物 (A)) またはその塩を、1) カルボニル基の不斉還元反応、

または、2) カルボニル基の不斉還元反応およびアミノ保護基の脱離反応、に付して、式

(B - 1) :

【化 1 6】



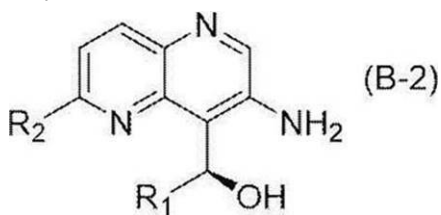
30

(式中、R₁およびR₂はそれぞれ前記と同義である。)

で表される化合物 (化合物 (B - 1)) またはその塩を得て、

2) 得られた化合物 (B - 1) と光学活性な有機酸との塩を晶析して、式 (B - 2) :

【化 1 7】



40

(式中、R₁およびR₂はそれぞれ前記と同義である。)

で表される化合物 (化合物 (B - 2)) またはその塩を得て、

3) 得られた化合物 (B - 2) またはその塩を、アルキル化反応に付して、式 (C) :

50

【化18】



(式中、 R_1 および R_2 は、それぞれ前記と同義であり、および R_3 は、 C_{1-6} アルキル基を示す。)

で表される化合物(化合物(C))またはその塩を得て、
4) 得られた化合物(C)またはその塩を、式(D) :

10

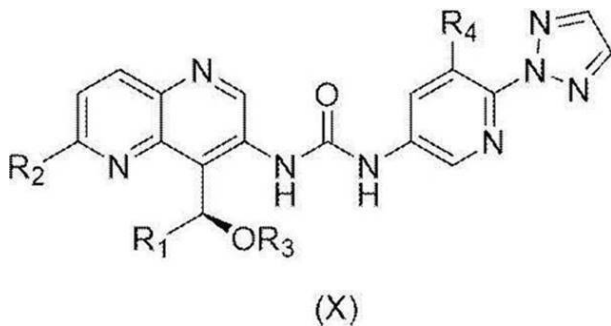
【化19】



(式中、 R_4 は、ハロゲン原子で置換されていてもよい C_{1-6} アルキル基、および R_7 は、水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよい C_{1-6} アルコキシ基、またはニトロ基で置換されていてもよいアリールオキシカルボニル基をそれぞれ示す。)
で表される化合物(化合物(D))またはその塩と反応させることを特徴とする、式(X)

20

【化20】



30

(式中、 $R_1 \sim R_4$ は、それぞれ前記と同義である。)

で表される化合物(化合物(X))またはその塩の製造方法。

【請求項13】

光学活性な有機酸が、D-(-)-酒石酸、L-(+)-酒石酸、(S)-(-)-2-ピリドン-5-カルボン酸、(R)-(+)-2-ピリドン-5-カルボン酸、L-リンゴ酸、D-リンゴ酸、(S)-(+)-カンファー-10-スルホン酸、(R)-(-)-カンファー-10-スルホン酸、(S)-(+)-2-(6-メトキシ-2-ナフチル)プロピオン酸、(R)-(-)-2-(6-メトキシ-2-ナフチル)プロピオン酸、(+)-cis-2-ベンズアミドシクロヘキサンカルボン酸、(-)-cis-2-ベンズアミドシクロヘキサンカルボン酸、デヒドロアピエチン酸、(R)-(-)-N-(3,5-ジニトロベンゾイル)-フェニルグリシン、(S)-(+)-N-(3,5-ジニトロベンゾイル)-フェニルグリシン、D-(-)-キナ酸およびL-(+)-キナ酸から選択される、請求項8~12のいずれか1項に記載の製造方法。

40

【請求項14】

光学活性な有機酸が、D-(-)-酒石酸である、請求項8~12のいずれか1項に記載の製造方法。

50

【請求項 15】

式 (C) :

【化 2 1】

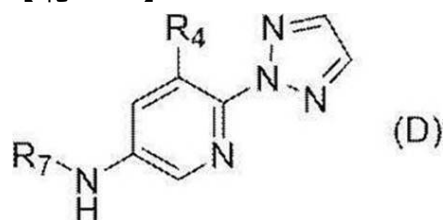


10

(式中、 R_1 はメチル基、
 R_2 は、 C_{1-6} アルキル基またはハロゲン原子、および
 R_3 は、 C_{1-6} アルキル基を示す。)

で表される化合物 (化合物 (C)) またはその塩を、式 (D) :

【化 2 2】

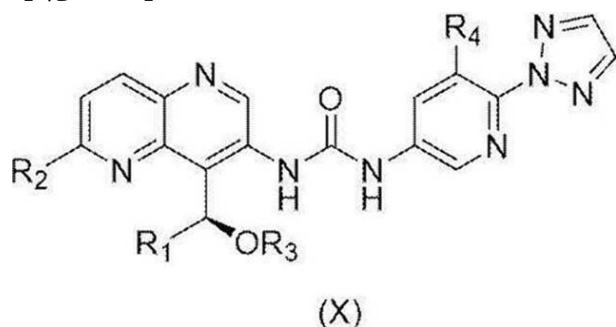


20

(式中、 R_4 は、ハロゲン原子で置換されていてもよい C_{1-6} アルキル基、および
 R_7 は、水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよい C_{1-6} アルコキシ基、または
 ニトロ基で置換されていてもよいアリールオキシカルボニル基をそれぞれ示す。)

で表される化合物 (化合物 (D)) またはその塩と反応させることを特徴とする、式 (X)

【化 2 3】



30

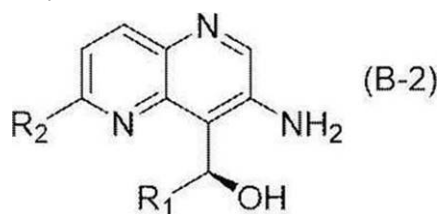
(式中、 $R_1 \sim R_4$ は、それぞれ前記と同義である。)

で表される化合物 (化合物 (X)) またはその塩の製造方法。

【請求項 16】

1) 式 (B-2) :

【化 2 4】

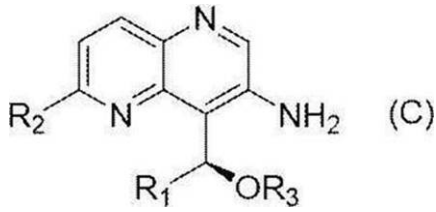


(式中、 R_1 はメチル基、および
 R_2 は、 C_{1-6} アルキル基またはハロゲン原子を示す。)

で表される化合物 (化合物 (B-2)) またはその塩を、アルキル化反応に付して、式 (50

C) :

【化 2 5】

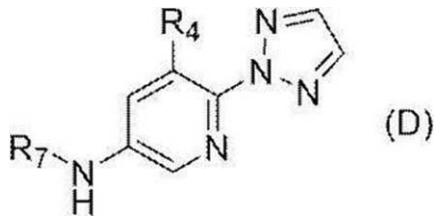


(式中、R₁およびR₂は、それぞれ前記と同義であり、およびR₃は、C₁-6アルキル基を示す。)

10

で表される化合物(化合物(C))またはその塩を得て、
2) 得られた化合物(C)またはその塩を、式(D) :

【化 2 6】

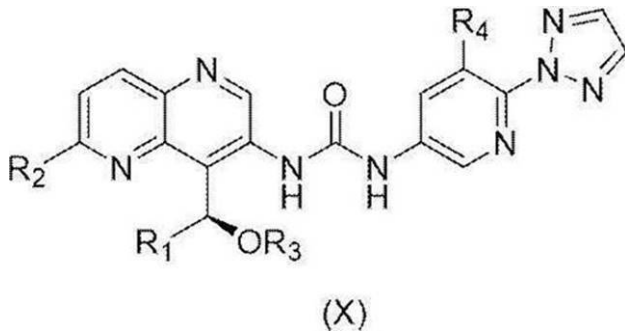


20

(式中、R₄は、ハロゲン原子で置換されていてもよいC₁-6アルキル基、およびR₇は、水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよいC₁-6アルコキシ基、またはニトロ基で置換されていてもよいアリールオキシカルボニル基をそれぞれ示す。)

で表される化合物(化合物(D))またはその塩と反応させることを特徴とする、式(X) :

【化 2 7】



30

(式中、R₁~R₄は、それぞれ前記と同義である。)

で表される化合物(化合物(X))またはその塩の製造方法。

【請求項 17】

式(C) :

40

【化 2 8】



(式中、R₁はメチル基、

R₂は、C₁-6アルキル基またはハロゲン原子、およびR₃は、C₁-6アルキル基を示す。)

50

で表される化合物（化合物（C））またはその塩。

10

20

30

40

50