

【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 3 年 6 月 17 日 (2021.6.17)

【公表番号】特表 2020-517668 (P2020-517668A)

【公表日】令和 2 年 6 月 18 日 (2020.6.18)

【年通号数】公開・登録公報 2020-024

【出願番号】特願 2019-557567 (P2019-557567)

【国際特許分類】

C 0 7 D 211/26 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/454 (2006.01)

C 0 7 D 401/04 (2006.01)

C 0 7 D 211/70 (2006.01)

C 0 7 D 211/74 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 211/26

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 K 31/454

C 0 7 D 401/04

C 0 7 D 211/70

C 0 7 D 211/74

【手続補正書】

【提出日】令和 3 年 4 月 26 日 (2021.4.26)

【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

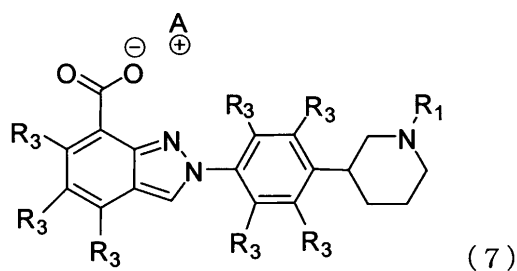
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (7) の塩：

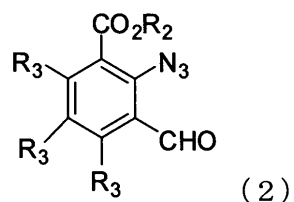
【化 1】



を製造する方法であって、

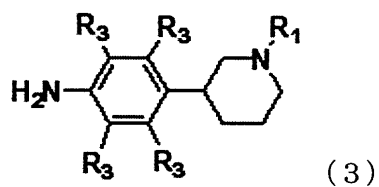
(a) 式 (2) の化合物：

【化 2】



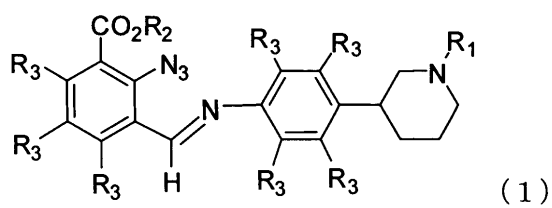
またはその塩を式 (3) の化合物：

【化 3】



またはその塩と接触させる工程、を含んでなる、式 (1) の化合物：

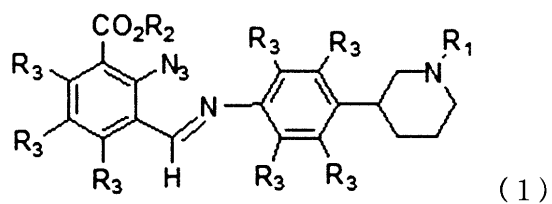
【化 4】



またはその塩を製造する工程、

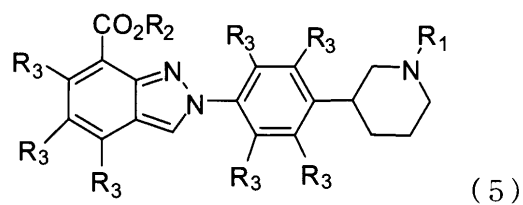
(b) 式 (1) の化合物：

【化 5】



またはその塩を触媒と接触させる工程、を含んでなる、式 (5) の化合物：

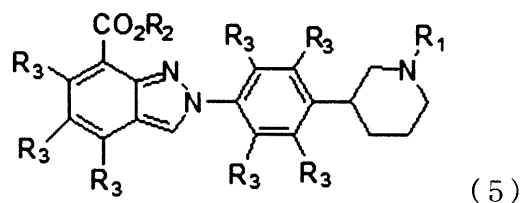
【化 6】



またはその塩を製造する工程、

(c) 式 (5) の化合物：

【化 7】



〔式中、

R₁ は、H またはアミン保護基であり；R₂ は、H、C₁ - 10 アルキル、C₁ - 10 ハロアルキル、またはアリールであり；各 R₃ は、独立に、H、ハロゲン、C₁ - 10 アルキル、C₁ - 10 ハロアルキル、またはアリールであり、かつ

A は、陽イオンである〕

またはその塩を金属水酸化物と接触させる工程、
を含んでなる、方法。

【請求項 2】

工程 (a) における接触がトリフルオロ酢酸 (TFA) の存在下で行われる、請求項 1
に記載の方法。

【請求項 3】

R₁ が、tert - ブチルオキシカルボニル (Boc)、9 - フルオレニルメチルオキシカルボニル (Fmoc)、カルボキシベンジル基 (Cbz)、p - メトキシベンジルカルボニル (Moz)、アセチル (Ac)、ベンゾイル (Bz)、p - メトキシベンジル (PMB)、3, 4 - ジメトキシベンジル (DMPM)、p - メトキシフェニル (PMP)、2 - ナフチルメチルエーテル (Nap)、トシル (Ts)、またはクロロギ酸トリクロロエチル (Troc) である、請求項 1 または 2 に記載の方法。

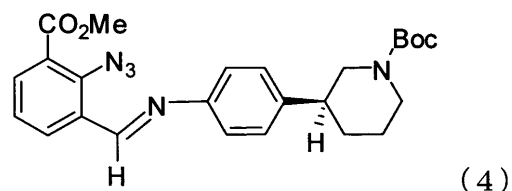
【請求項 4】

R₁ が、tert - ブチルオキシカルボニル基 (Boc) である、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 5】

前記式 (1) の化合物またはその塩が、式 (4)：

【化 8】



の構造を有する、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 6】

工程 (b) における前記触媒がトリフルオロメタンスルホン酸銅 (II) (Cu(OTf)₂) である、請求項 1 に記載の方法。

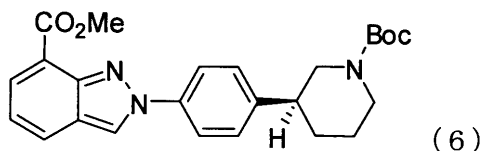
【請求項 7】

工程 (b) における接触がテトラヒドロフラン (THF) の存在下で行われる、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 8】

工程 (b) の前記式 (5) の化合物が、式 (6)：

【化 9】



の構造を有する、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 9】

工程 (c) における前記陽イオンがアルカリ金属陽イオンである、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 10】

前記アルカリ金属陽イオンがリチウム陽イオンである、請求項 9 に記載の方法。

【請求項 11】

R_1 がアミン保護基である、請求項 9 または 10 に記載の方法。

【請求項 12】

前記アミン保護基が、tert-ブチルオキシカルボニル (Boc)、9-フルオレニルメチルオキシカルボニル (Fmoc)、カルボキシベンジル基 (Cbz)、p-メトキシベンジルカルボニル (Moz)、アセチル (Ac)、ベンゾイル (Bz)、p-メトキシベンジル (PMB)、3,4-ジメトキシベンジル (DMPM)、p-メトキシフェニル (PMP)、2-ナフチルメチルエーテル (Nap)、トシル (Ts)、またはクロロギ酸トリクロロエチル (Troc) である、請求項 11 に記載の方法。

【請求項 13】

前記アミン保護基が、tert-ブチルオキシカルボニル基 (Boc) である、請求項 12 に記載の方法。

【請求項 14】

R_2 が C_{1-10} アルキルである、請求項 1 または 9 ~ 13 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 15】

R_2 がメチルである、請求項 14 に記載の方法。

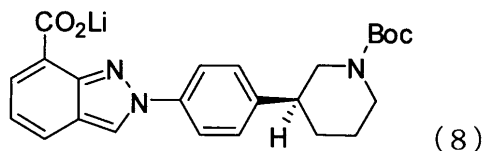
【請求項 16】

各 R_3 が H である、請求項 1 または 9 ~ 15 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 17】

前記式 (7) の塩が、式 (8) :

【化 10】

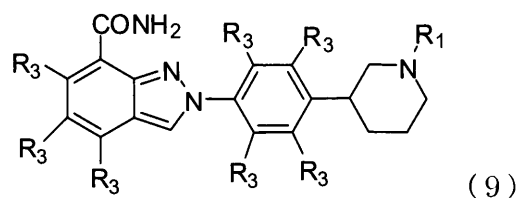


の構造を有する、請求項 16 に記載の方法。

【請求項 18】

式 (9) の化合物 :

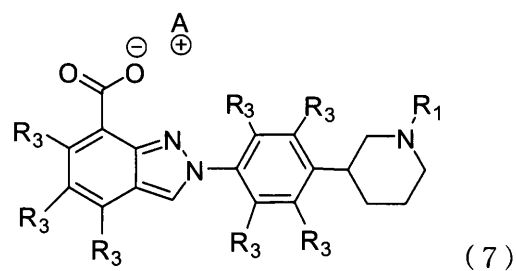
【化 1 1】



またはその塩を製造する方法であって、

式 (7) の化合物：

【化 1 2】



[式中、

R_1 は、H またはアミン保護基であり；

R_2 は、H、 C_{1-10} アルキル、 C_{1-10} ハロアルキル、またはアリールであり；

各 R_3 は、独立に、H、ハロゲン、 C_{1-10} アルキル、 C_{1-10} ハロアルキル、またはアリールであり；かつ

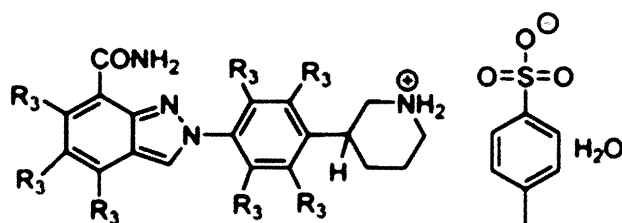
A は、陽イオンである]

またはその塩をカップリング試薬および水酸化アンモニウムと接触させる工程を含んでなる、方法。

【請求項 19】

前記式 (9) の化合物またはその塩が、以下：

【化 1 3】

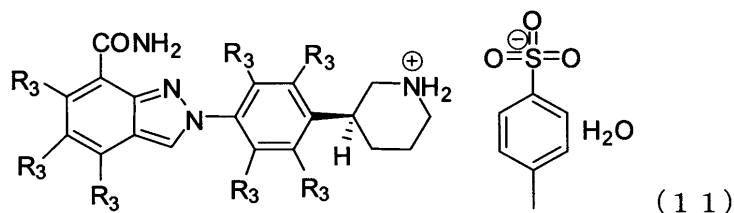


の構造を有する、請求項 18 に記載の方法。

【請求項 20】

前記式 (9) の化合物またはその塩が、式 (11)：

【化 1 4】

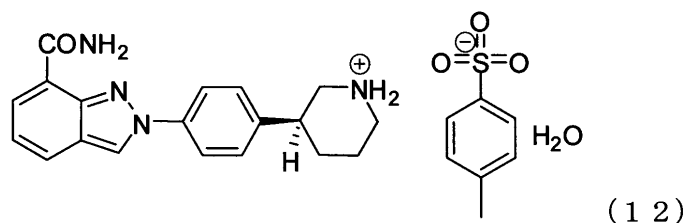


の構造を有する、請求項 18 に記載の方法。

【請求項 2 1】

前記式 (9) の化合物またはその塩が、式 (12) :

【化 1 5】

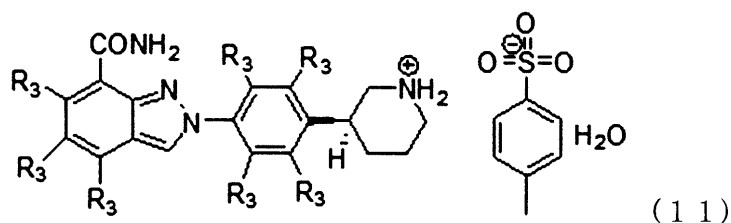


の構造を有する、請求項 18 に記載の方法。

【請求項 2 2】

式 (11) の塩 :

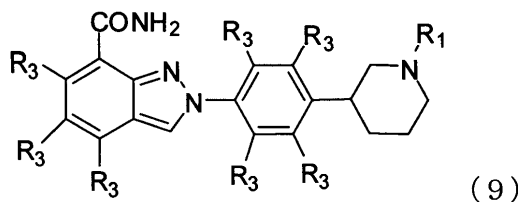
【化 1 6】



を製造する方法であって、

式 (9) の化合物 :

【化 1 7】



[式中、

R_1 は、H またはアミン保護基であり ;

R_2 は、H、 C_{1-10} アルキル、 C_{1-10} ハロアルキル、またはアリールであり ;
かつ

各 R_3 は、独立に、H、ハロゲン、 C_{1-10} アルキル、 C_{1-10} ハロアルキル、またはアリールである]

またはその塩をパラ-トルエンスルホン酸一水和物 ($pTSA \cdot H_2O$) と接触させる工程を含んでなる、方法。

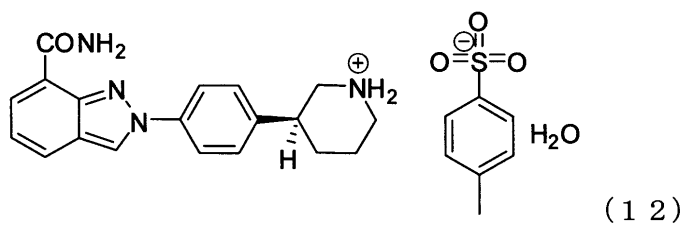
【請求項 2 3】

各 R₃ が H である、請求項 22 に記載の方法。

【請求項 24】

前記式 (11) の塩が、式 (12)：

【化 18】



の構造を有する、請求項 23 に記載の方法。