

【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 07 D 211/26 (2006.01)

A 61 P 35/00 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

A 61 K 31/454 (2006.01)

C 07 D 401/04 (2006.01)

C 07 D 211/70 (2006.01)

C 07 D 211/74 (2006.01)

【F I】

C 07 D 211/26

A 61 P 35/00

A 61 P 43/00 1 1 1

A 61 K 31/454

C 07 D 401/04

C 07 D 211/70

C 07 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

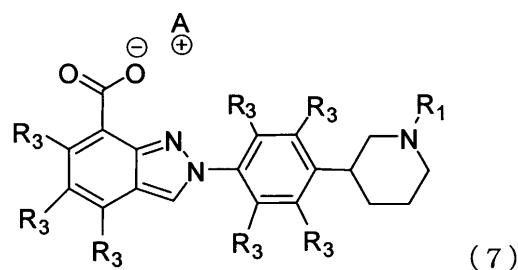
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(7)の塩：

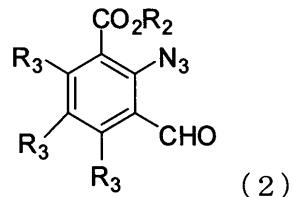
【化1】



を製造する方法であつて、

(a) 式(2)の化合物：

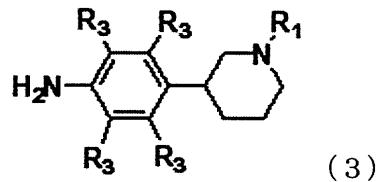
【化2】



(2)

またはその塩を式(3)の化合物：

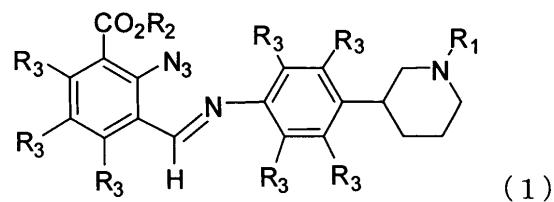
【化3】



(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：

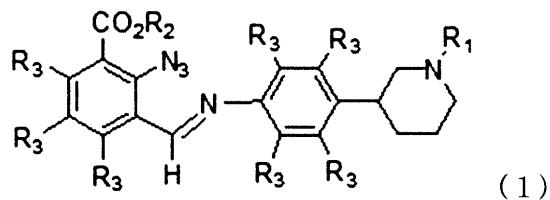
【化4】



(1)

またはその塩を製造する工程、(b) 式(1)の化合物：

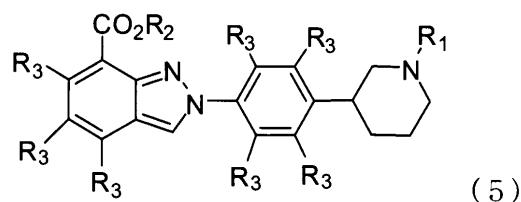
【化5】



(1)

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：

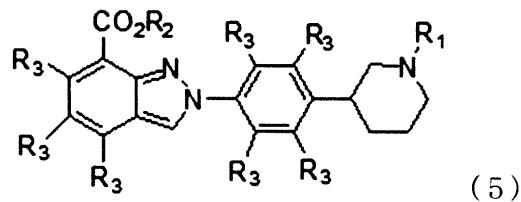
【化6】



(5)

またはその塩を製造する工程、(c) 式(5)の化合物：

## 【化7】



[式中、

R<sub>1</sub>は、Hまたはアミン保護基であり；

R<sub>2</sub>は、H、C<sub>1～10</sub>アルキル、C<sub>1～10</sub>ハロアルキル、またはアリールであり；

各R<sub>3</sub>は、独立に、H、ハログン、C<sub>1～10</sub>アルキル、C<sub>1～10</sub>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】

R<sub>1</sub>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)、トシリル(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。

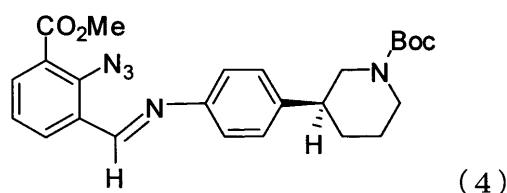
## 【請求項4】

R<sub>1</sub>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(Cu(OTf)<sub>2</sub>)である、請求項1に記載の方法。

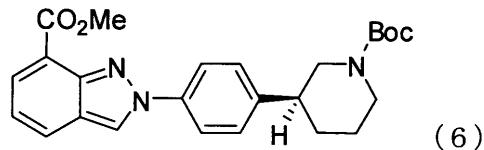
## 【請求項7】

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<sub>1</sub>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)、トシリル(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<sub>2</sub>がC<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>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<sub>2</sub>がメチルである、請求項14に記載の方法。

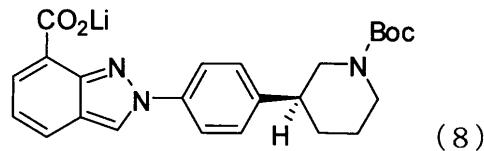
## 【請求項16】

各R<sub>3</sub>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】

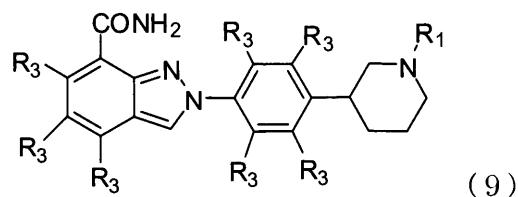


の構造を有する、請求項16に記載の方法。

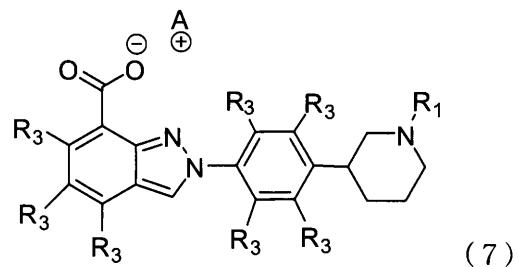
## 【請求項18】

式(9)の化合物：

【化11】

またはその塩を製造する方法であって、式(7)の化合物：

【化12】



[式中、

R<sub>1</sub>は、Hまたはアミン保護基であり；R<sub>2</sub>は、H、C<sub>1-10</sub>アルキル、C<sub>1-10</sub>ハロアルキル、またはアリールであり；各R<sub>3</sub>は、独立に、H、ハロゲン、C<sub>1-10</sub>アルキル、C<sub>1-10</sub>ハロアルキル、またはアリールであり；かつ

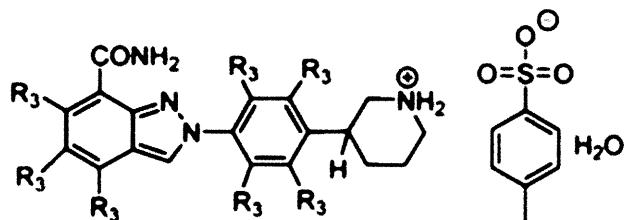
Aは、陽イオンである]

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：

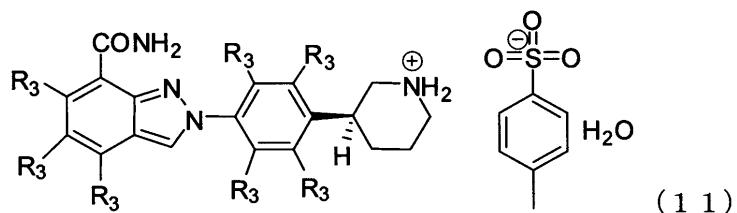
【化13】

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)：

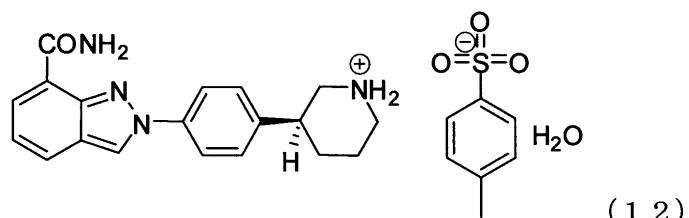
【化14】

の構造を有する、請求項18に記載の方法。

【請求項21】

前記式(9)の化合物またはその塩が、式(12)：

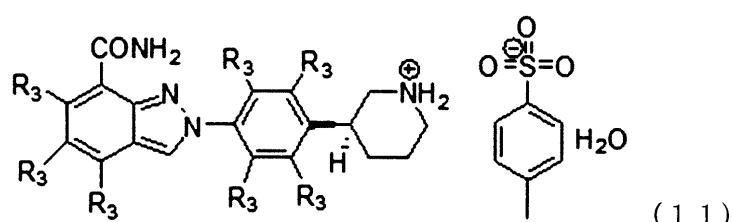
【化15】

の構造を有する、請求項18に記載の方法。

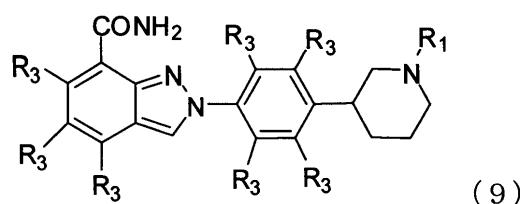
【請求項22】

式(11)の塩：

【化16】

を製造する方法であつて、式(9)の化合物：

【化17】



[式中、

R<sub>1</sub>は、Hまたはアミン保護基であり；R<sub>2</sub>は、H、C<sub>1-10</sub>アルキル、C<sub>1-10</sub>ハロアルキル、またはアリールであり；かつ各R<sub>3</sub>は、独立に、H、ハロゲン、C<sub>1-10</sub>アルキル、C<sub>1-10</sub>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·H<sub>2</sub>O)と接触させる工程を含んでなる、方法。

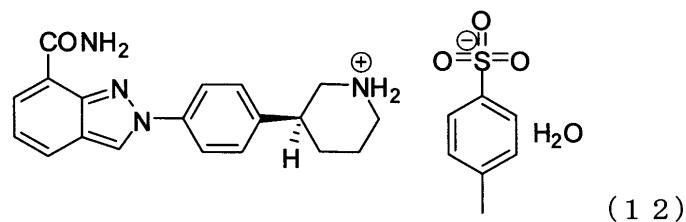
【請求項23】

各 R<sub>3</sub> が H である、請求項2\_2に記載の方法。

【請求項 2\_4】

前記式(11)の塩が、式(12)：

【化 18】



の構造を有する、請求項2\_3に記載の方法。