

【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5年2月3日(2023.2.3)

【公開番号】特開2022-116233(P2022-116233A)

【公開日】令和4年8月9日(2022.8.9)

【年通号数】公開公報(特許)2022-145

【出願番号】特願2022-88172(P2022-88172)

【国際特許分類】

C 0 7 D 4 8 7 / 1 8 (2 0 0 6 . 0 1)

10

A 6 1 K 3 1 / 5 5 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 4 3 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 2 9 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 3 7 / 0 6 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 2 5 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 2 5 / 2 8 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 2 5 / 0 4 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 9 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 3 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 2 7 / 0 2 (2 0 0 6 . 0 1)

20

A 6 1 P 3 5 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 4 5 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

【 F I 】

C 0 7 D 4 8 7 / 1 8 C S P

A 6 1 K 3 1 / 5 5

A 6 1 P 4 3 / 0 0 1 1 1

A 6 1 P 2 9 / 0 0

A 6 1 P 3 7 / 0 6

A 6 1 P 2 5 / 0 0

A 6 1 P 2 5 / 2 8

30

A 6 1 P 2 5 / 0 4

A 6 1 P 9 / 0 0

A 6 1 P 3 / 0 0

A 6 1 P 2 7 / 0 2

A 6 1 P 3 5 / 0 0

A 6 1 P 4 3 / 0 0 1 2 1

A 6 1 K 4 5 / 0 0

【手続補正書】

【提出日】令和5年1月26日(2023.1.26)

40

【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

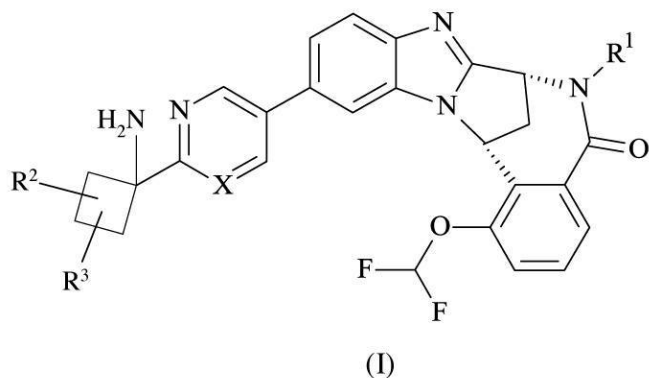
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

下記を含む、式(I)の化合物、又はその薬学的に許容される塩を調製する方法：

【化 1】



10

式中、

X は N 又は C - F を表し；

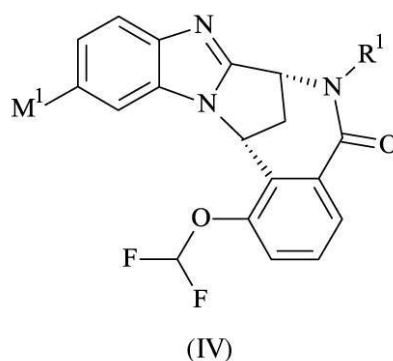
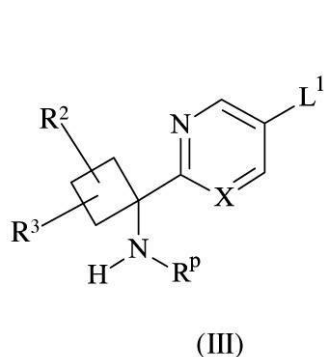
R¹ は水素又はメチルを表し；

R² は水素、メチル又はトリフルオロメチルを表し；そして

R³ は、水素、シアノ、ヒドロキシ又はヒドロキシメチルを表す；

下記式 (I I I) の化合物を下記式 (I V) の化合物と反応させること：

【化 2】



20

式中、

L¹ は脱離基を表し、

M¹ はボロン酸部分 - B (O H)₂ 又は有機ジオールで形成されたその環状エステルを表し、

R^p は N - 保護基を表す；

前記反応は遷移金属触媒の存在下で行われ、

その後必要に応じて、N - 保護基 R^p は除去される。

【請求項 2】

脱離基 L¹ がハロゲン原子である、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 3】

脱離基 L¹ が臭素である、請求項 1 又は 2 に記載の方法。

40

【請求項 4】

N - 保護基 R^p が tert - ブトキシカルボニル又は tert - ブチルスルフィニルである、請求項 1 ~ 3 のいずれかに記載の方法。

【請求項 5】

N - 保護基 R^p が酸処理により除去される、請求項 4 に記載の方法。

【請求項 6】

遷移金属触媒がトリス (ジベンジリデンアセトン) ジパラジウム (0)、もしくは [1 , 1 ' - ビス (ジフェニルホスフィノ) フェロセン] ジクロロパラジウム (I I)、又はクロロ (2 - ジシクロヘキシルホスフィノ - 2 ' , 4 ' , 6 ' - トリイソプロピル - 1 , 1 ')

50

- ビフェニル) [2 - (2' - アミノ - 1 , 1' - ビフェニル)] パラジウム (I I) である、請求項 1 ~ 5 のいずれかに記載の方法。

【請求項 7】

遷移金属触媒が 2 - ジシクロヘキシルホスフィノ - 2' , 4' , 6' - トリイソプロピルビフェニル又はトリシクロヘキシルホスホニウムテトラフルオロボラートと組み合わせて用いられる、請求項 6 に記載の方法。

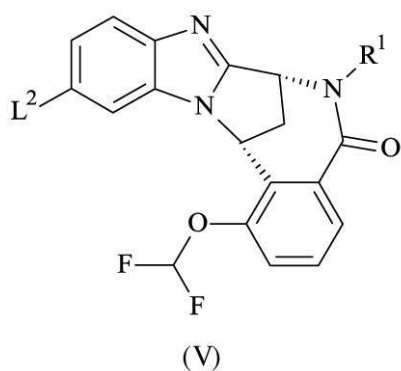
【請求項 8】

式 (I I I) の化合物と式 (I V) の化合物との反応が、リン酸カリウム又は炭酸カリウムの存在下で行われる、請求項 1 ~ 7 のいずれかに記載の方法。

【請求項 9】

M^1 がピナコールにより形成されたボロン酸部分 - B (O H) ₂ の環状エステルであり、式 (I V) の化合物がビス - (ピナコラト) ジボロンを式 (V) の化合物と反応させることにより調製される、請求項 1 ~ 8 のいずれかに記載の方法：

【化 3】



(V)

式中、L² は脱離基を表し；

前記反応は遷移金属触媒の存在下で行われる。

【請求項 10】

以下から選択される化合物。

10

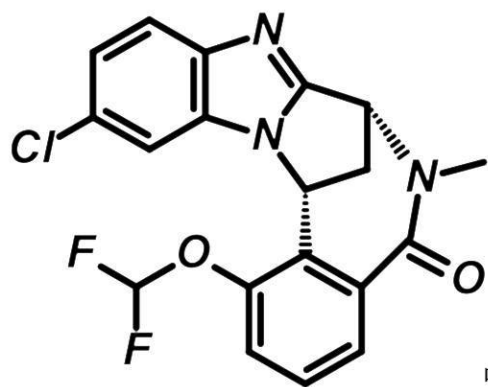
20

30

40

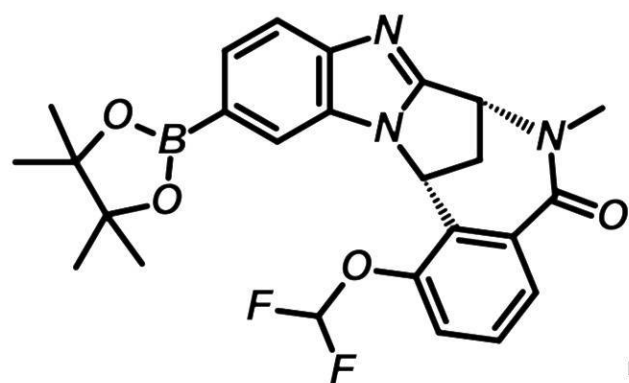
50

【化 4】



中間体 3;

10



中間体 4;

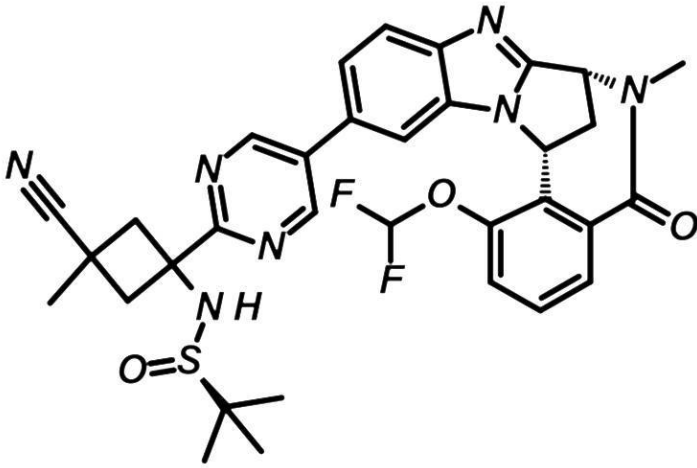
20

30

40

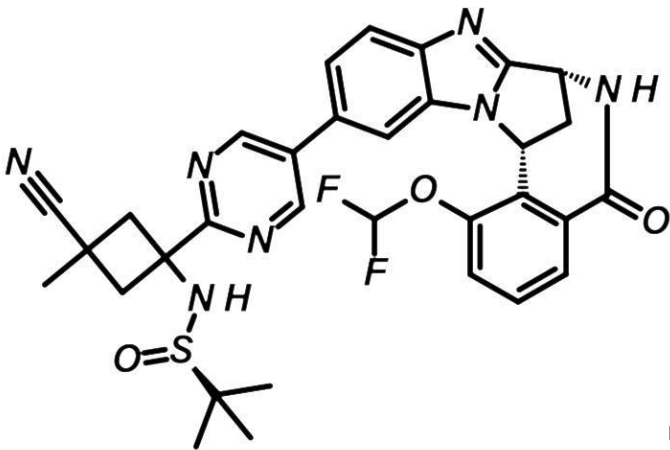
50

【化 5】



10

中間体 5;



20

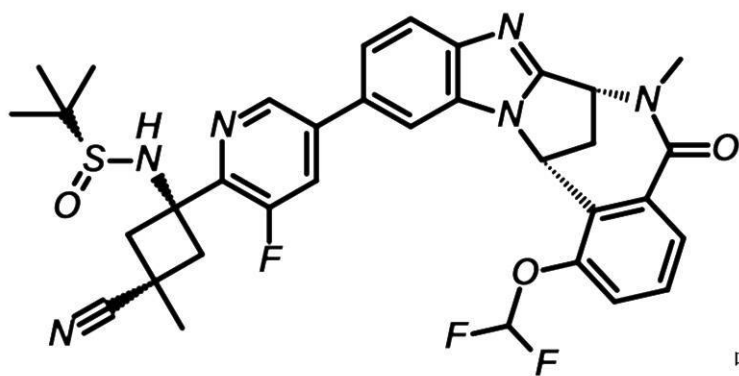
中間体 6;

30

40

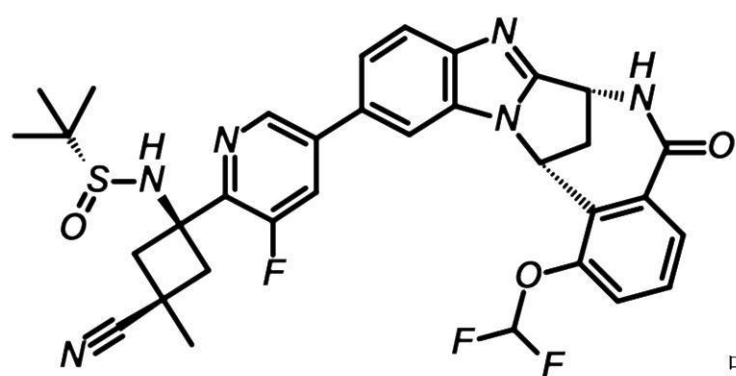
50

【化 6】



中間体 8;

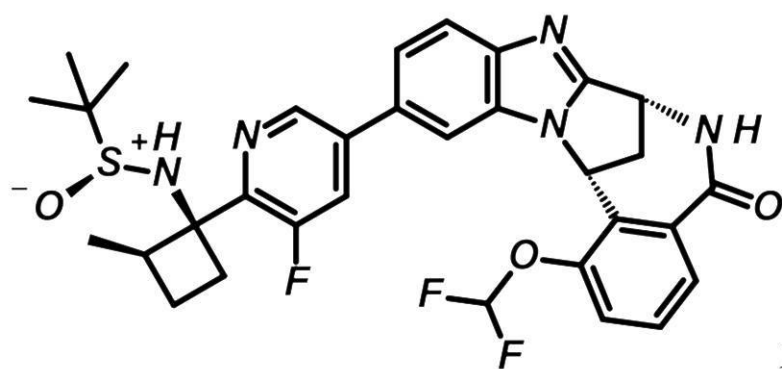
10



中間体 9;

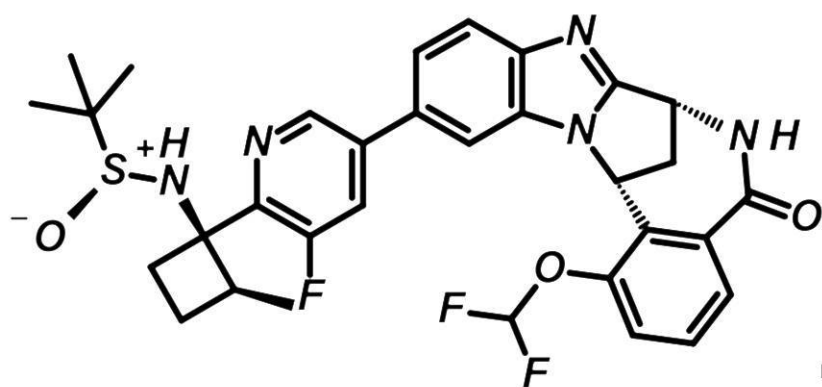
20

【化 7】



又は

30

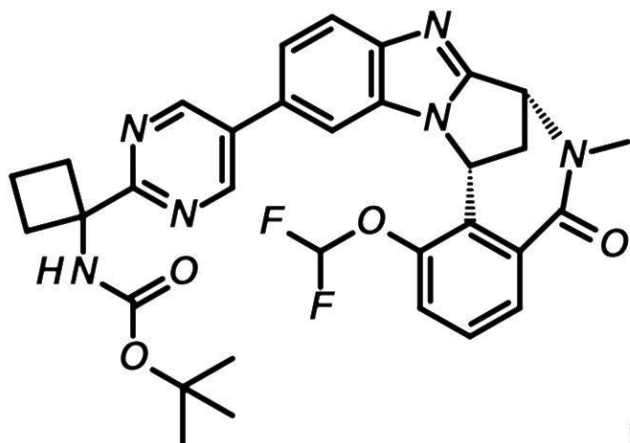


中間体 12;

40

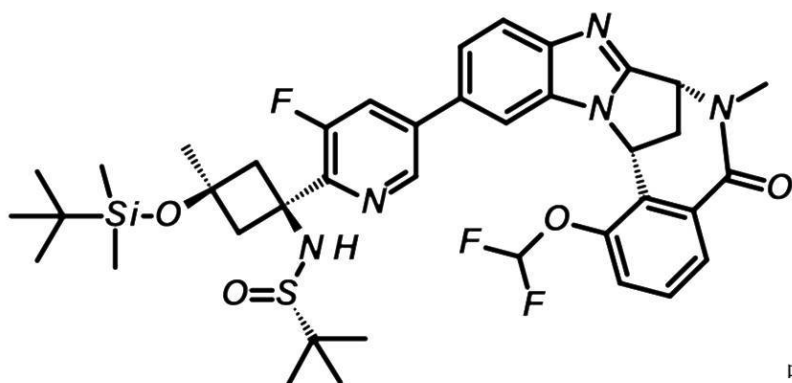
50

【化 8】



中間体 17;

10



中間体 24;

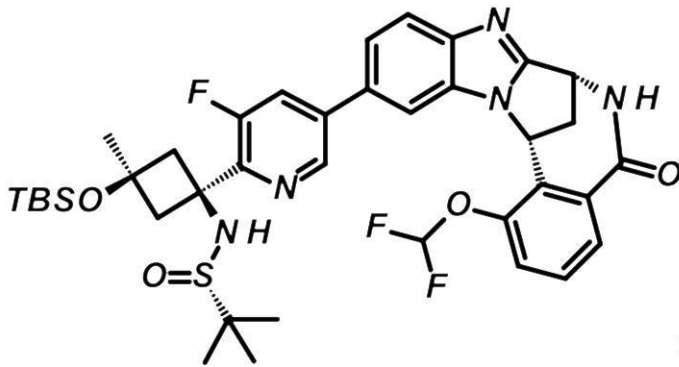
20

30

40

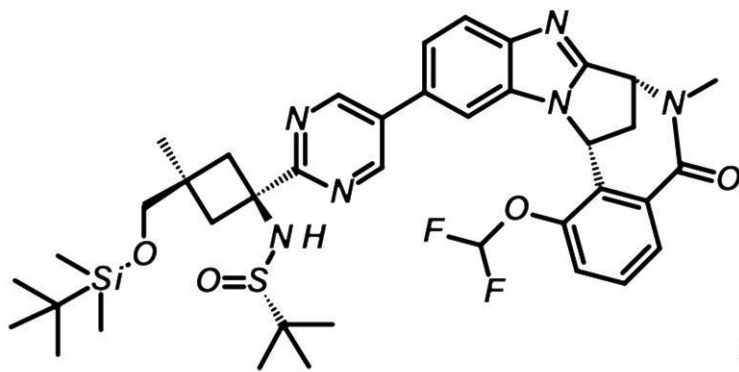
50

【化 9】



中間体 25;

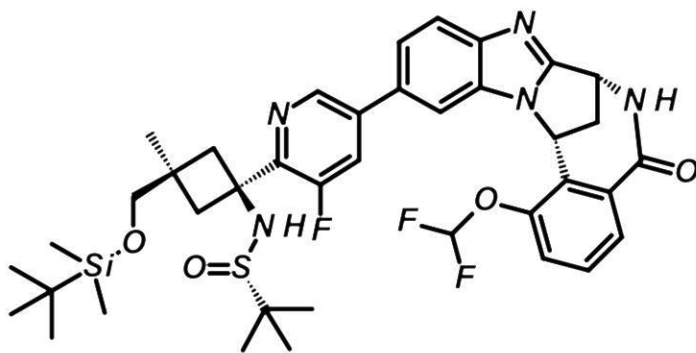
10



中間体 33;

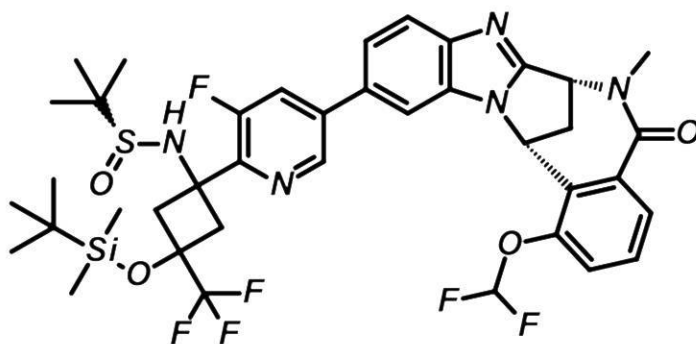
20

【化 10】



中間体 35;

30

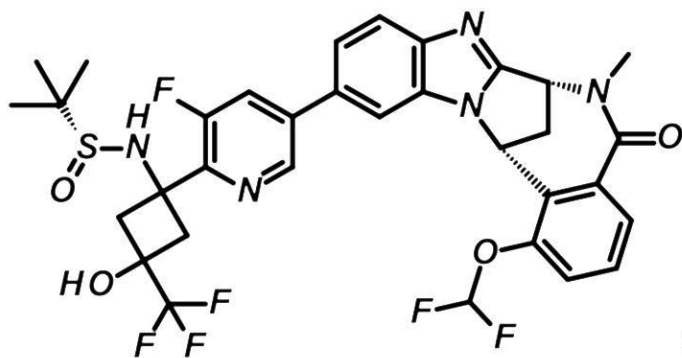


中間体 42;

40

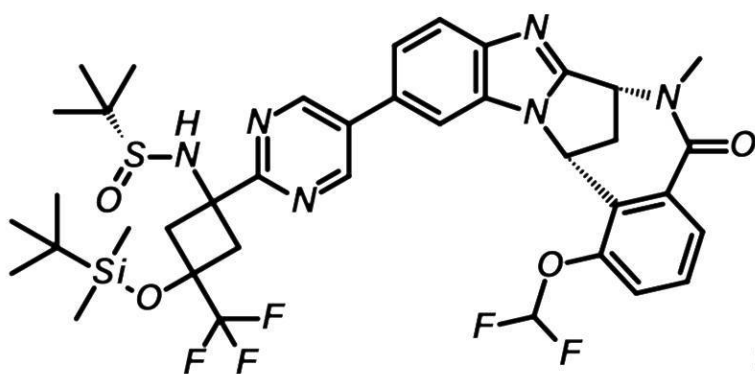
50

【化 1 1】



中間体 43;

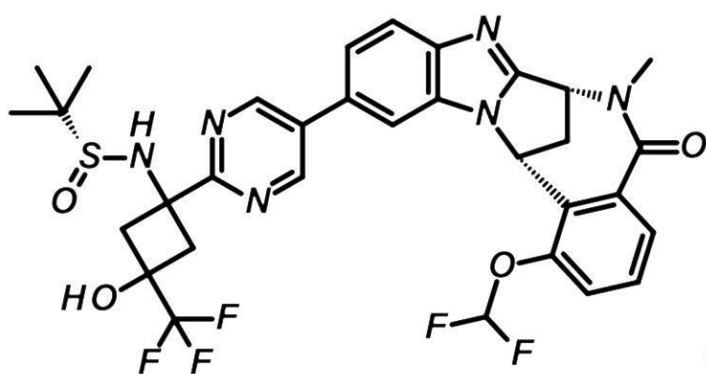
10



中間体 45;

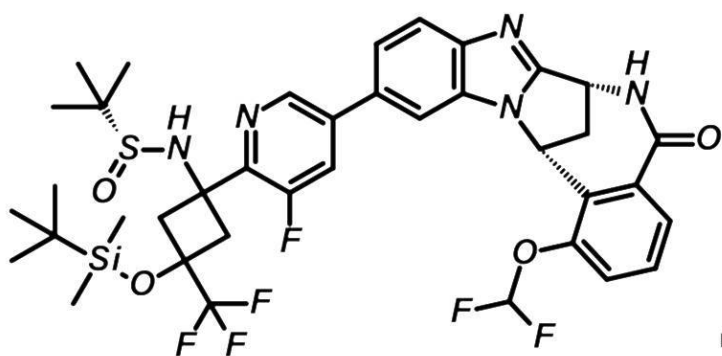
20

【化 1 2】



中間体 46;

30

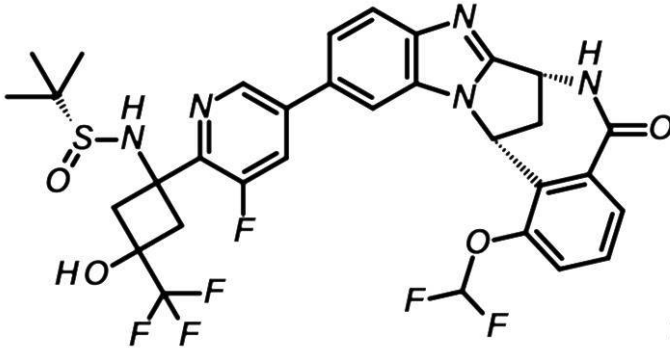


中間体 47;

40

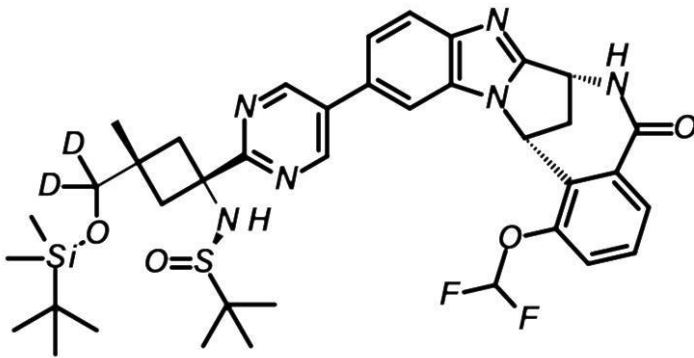
50

【化 1 3】



中間体 48;

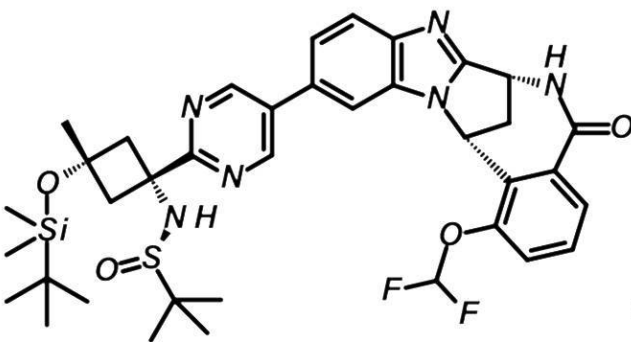
10



中間体 56;

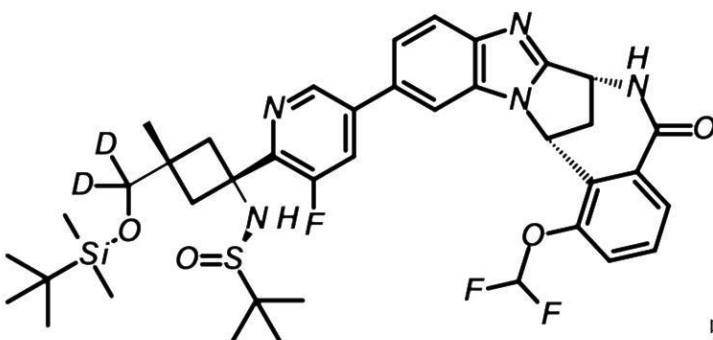
20

【化 1 4】



中間体 57;

30



中間体 59

40

50