

【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3月1日(2018.3.1)

【公開番号】特開2018-8959(P2018-8959A)

【公開日】平成30年1月18日(2018.1.18)

【年通号数】公開・登録公報2018-002

【出願番号】特願2017-135083(P2017-135083)

【国際特許分類】

C 07 D 498/04 (2006.01)

A 61 P 35/00 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

A 61 K 31/553 (2006.01)

C 07 B 61/00 (2006.01)

【F I】

C 07 D 498/04 1 1 6

A 61 P 35/00

A 61 P 43/00 1 0 5

A 61 K 31/553

A 61 P 43/00 1 1 1

C 07 B 61/00 3 0 0

【手続補正書】

【提出日】平成30年1月5日(2018.1.5)

【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】

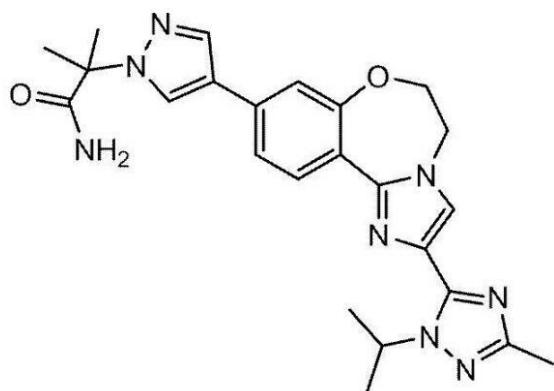
構造：



3 3 を有する化合物。

【請求項2】

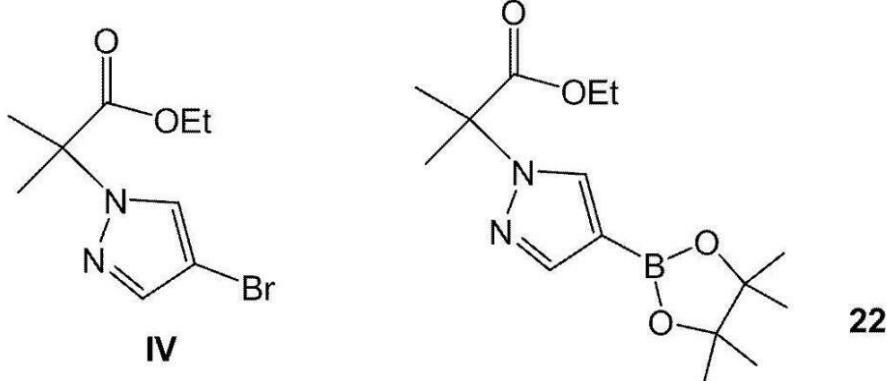
構造：



I

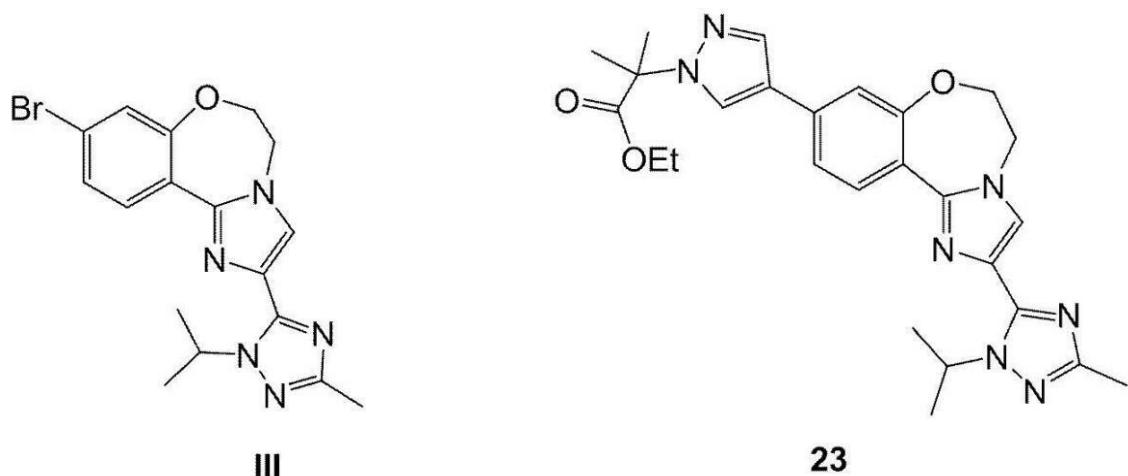
を有する (2 - (4 - (2 - (1 - イソプロピル - 3 - メチル - 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 5 - イル) - 5 , 6 - ジヒドロベンゾ [f] イミダゾ [1 , 2 - d] [1 , 4] オキサゼビン - 9 - イル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル) - 2 - メチルプロパンアミド I、並びにその立体異性体、幾何異性体、互変異性体及び薬学的に許容される塩の調製方法であって、

(a) IV と 4 , 4 ' , 4 ' , 5 , 5 , 5 ' , 5 ' - オクタメチル - 2 , 2 ' - ビ (1 , 3 , 2 - ジオキサボロラン) とを反応させて 22 を形成すること



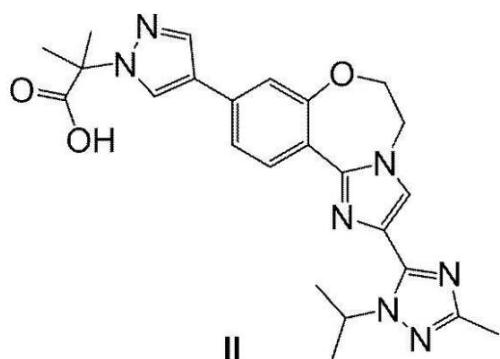
;

(b) 22 、パラジウム触媒、及び III を反応させて 23 を形成すること



;

(c) 23 を、水性塩基性試薬と反応させて I I を形成すること

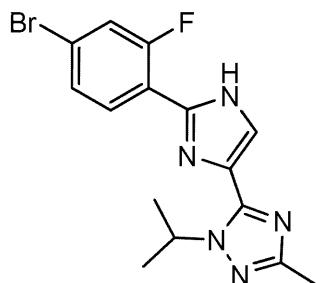


; 並びに

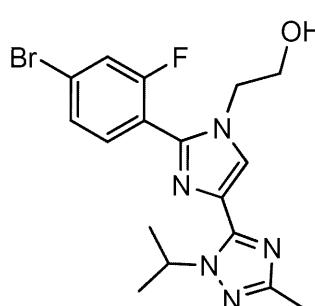
(d) IIを、アシル活性剤と、次いでアンモニアと反応させてIを得ることを含み、

IIが、

(a) Vを2-ヒドロキシエチル化試薬と反応させて14を形成すること



V



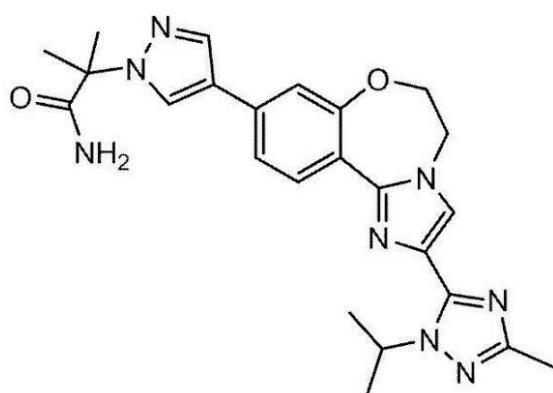
14

; 及び

(b) 14を水性塩基性試薬と反応させてVを形成することにより調製される、方法。

【請求項3】

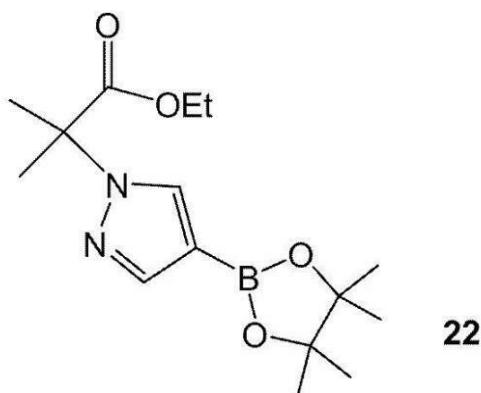
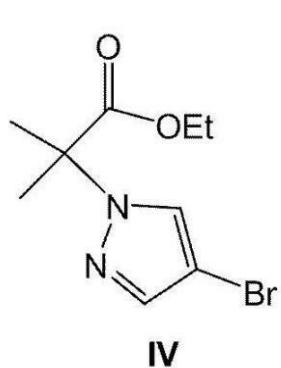
構造：



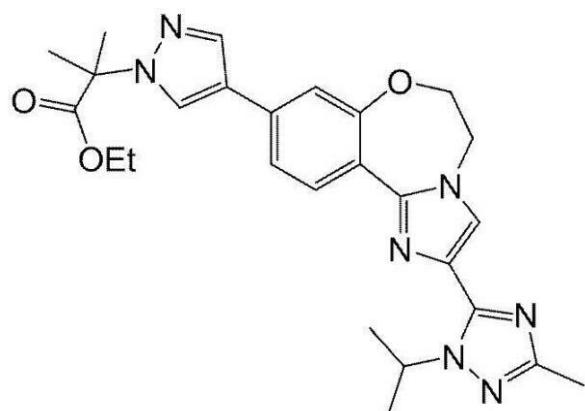
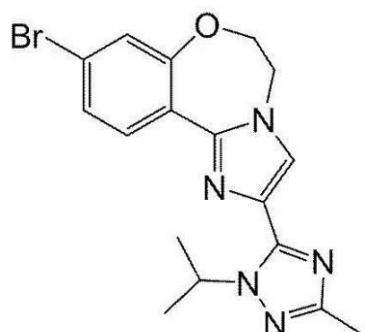
I

を有する(2-(4-(2-(4,4-dimethyl-4H-1,2-dihydro-4-oxo-5H-1,2,4-triazole-3-yl)ethyl)phenoxy)-4,4-dimethyl-4H-1,2-dihydro-4-oxo-5H-1,2,4-triazole-3-carboxamide)、並びにその立体異性体、幾何異性体、互変異性体及び薬学的に許容される塩の調製方法であって、

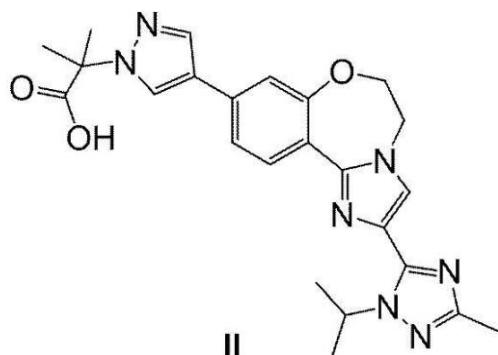
(a) IVと4,4',4'',5,5',5''-オクタメチル-2,2'-ビ(1,3,2-ジオキサボロラン)とを反応させて22を形成すること



; (b) 22、パラジウム触媒、及びIIIを反応させて23を形成すること



; (c) 23を、水性塩基性試薬と反応させてIIを形成すること

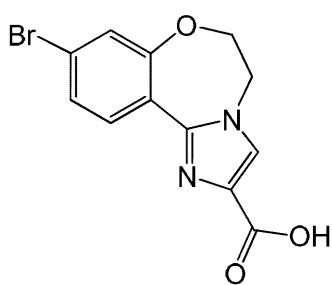


; 並びに

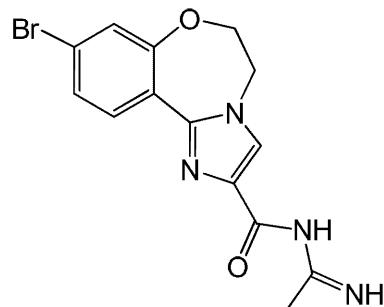
(d) IIを、アシリル活性剤と、次いでアンモニアと反応させてIを得ることを含み、

I IIIが、

(a) 28をアセトアミジンと反応させて29を形成すること



28



29

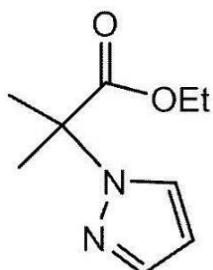
; 及び

(b) 29をイソプロピルヒドラジン及び酸性試薬と反応させてIIIを形成すること

により調製される、方法。

【請求項4】

IVが、17：



17

を臭素化試薬と反応させることにより調製される、請求項2又は3に記載の方法。

【請求項5】

パラジウム触媒が、PdCl₂(PPh₃)₂、Pd(t-Bu)₃、PdCl₂dppf、CH₂Cl₂、Pd(PPh₃)₄、Pd(OAc)/PPh₃、Cl₂Pd[PdCl₂(PPh₃)₂]、Pd(DIPHOS)₂、Cl₂Pd(Bipy)、[PdCl₂(Ph₂PC₂H₂PPh₂)]₂、Cl₂Pd[P(o-tol)₃]₂、Pd₂(dba)₃/P(o-tol)₃、Pd₂(dba)/P(furyl)₃、Cl₂Pd[P(furyl)₃]₂、Cl₂Pd(PMePh₂)₂、Cl₂Pd[P(4-F-Ph)₃]₂、Cl₂Pd[P(C₆F₆)₃]₂、Cl₂Pd[P(2-COOH-Ph)(Ph)₂]₂、並びにカプセル化された触媒Pd EncatTM 30、Pd EncatTM TPP30、及びPd(II)EncatTM BINAP30から選択される、請求項2から4のいずれか一項に記載の方法。

【請求項6】

パラジウムが、固体の吸着性パラジウム消去剤によって除去される、請求項2から5のいずれか一項に記載の方法。

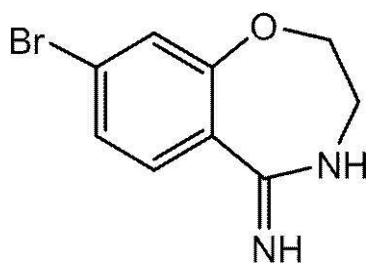
【請求項7】

固体の吸着性パラジウム消去剤が、シリカゲル、孔制御ガラス、及び低度架橋ポリスチレンから選択される、請求項6に記載の方法。

【請求項8】

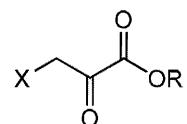
28が、

33：



3 3

を以下の化合物：



[上式中、X はハロであり、R はH またはアルキルである]
と反応させることにより調製される、請求項 3 に記載の方法。