

【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 4 月 30 日 (2021.4.30)

【公表番号】特表 2020-510063 (P2020-510063A)

【公表日】令和 2 年 4 月 2 日 (2020.4.2)

【年通号数】公開・登録公報 2020-013

【出願番号】特願 2019-550605 (P2019-550605)

【国際特許分類】

C 0 7 D 495/14 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/06 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 19/00 (2006.01)

A 6 1 P 3/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 11/06 (2006.01)

A 6 1 P 37/08 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 5/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/551 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 495/14 C S P E

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 37/06

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 19/00

A 6 1 P 3/00

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 11/06

A 6 1 P 37/08

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 5/00

A 6 1 K 31/551

【手続補正書】

【提出日】令和 3 年 3 月 12 日 (2021.3.12)

【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

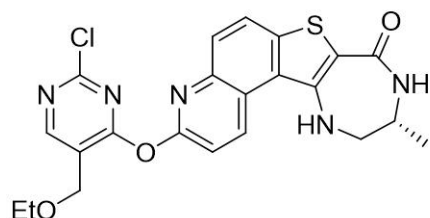
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

化合物 I :

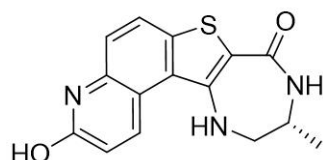
【化 1】



I

またはその医薬的に許容される塩の製造方法であって、式 1-11 :

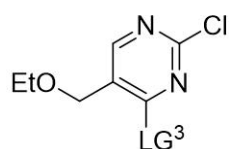
【化 2】



1-11

の化合物またはその塩を、式 1-12 :

【化 3】



1-12

[式中、LG³ は適切な脱離基である]

で示される化合物と、適切な反応条件下で反応させて、化合物 I またはその医薬的に許容される塩を得る工程を含む、方法。

【請求項 2】

LG³ がハロゲンである、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 3】

LG³ がクロロである、請求項 2 に記載の方法。

【請求項 4】

反応条件が塩基を含む、請求項 1-3 のいずれか一項に記載の方法。

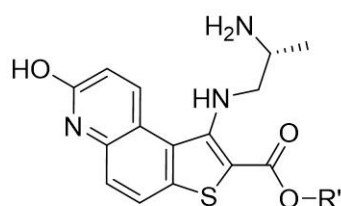
【請求項 5】

塩基が K₂CO₃ である、請求項 4 に記載の方法。

【請求項 6】

式 1-11 の化合物が、式 1-10 :

【化 4】



1-10

[式中、R' は水素または所望により置換されてもよい C₁₋₆ 脂肪族基またはアリール

である]

で示される化合物またはその塩を、適切な反応条件下で反応させて、式 1-11 の化合物またはその塩を得ることを含むプロセスによって製造される、請求項 1～5 いずれかに記載の方法。

【請求項 7】

R' が C₁ - 6 脂肪族基である、請求項 6 に記載の方法。

【請求項 8】

R' がメチルである、請求項 7 に記載の方法。

【請求項 9】

反応条件が塩基を含む、請求項 6 - 8 のいずれか一項に記載の方法。

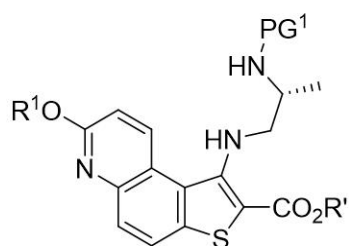
【請求項 10】

塩基が DBU である、請求項 9 に記載の方法。

【請求項 11】

式 1-10 の化合物が、式 1-9 :

【化 5】



1-9

[式中、

R¹ は適切な酸素保護基であり；および

PG¹ は適切な窒素保護基である]

で示される化合物またはその塩を、適切な反応条件下で反応させて、式 1-10 の化合物またはその塩を得ることを含むプロセスによって製造される、請求項 6 - 10 いずれかに記載の方法。

【請求項 12】

R' が C₁ - 6 脂肪族基である、請求項 11 に記載の方法。

【請求項 13】

R' がメチルである、請求項 12 に記載の方法。

【請求項 14】

PG¹ が Boc である、請求項 11 - 13 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 15】

R¹ がベンジルである、請求項 11 - 14 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 16】

反応条件が酸を含む、請求項 11 - 15 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 17】

酸が HCl である、請求項 16 に記載の方法。

【請求項 18】

酸が BSA である、請求項 16 に記載の方法。

【請求項 19】

式 1-10 の化合物が HCl 塩として提供される、請求項 11 - 17 のいずれか一項に記載の方法。

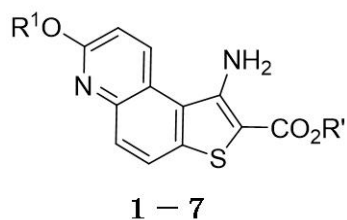
【請求項 20】

式 1-10 の化合物が BSA 塩として提供される、請求項 11 - 16 および 18 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 21】

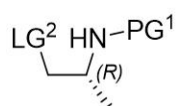
式 1-9 の化合物が、式 1-7 :

【化 6】



の化合物またはその塩を、式 1-8 :

【化 7】



[式中、LG² は適切な脱離基である]

で示される化合物またはその塩と、適切な反応条件下で反応させて、式 1-9 の化合物またはその塩を得ることを含むプロセスによって製造される、請求項 11-20 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 22】

R' が C₁₋₆ 脂肪族基である、請求項 21 に記載の方法。

【請求項 23】

R' がメチルである、請求項 22 に記載の方法。

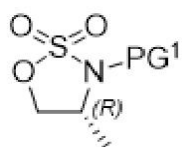
【請求項 24】

R¹ がベンジルである、請求項 21-23 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 25】

式 1-8 の化合物が

【化 8】



である、請求項 21-24 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 26】

PG¹ が Boc である、請求項 21-25 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 27】

反応条件が塩基を含む、請求項 21-26 のいずれか一項に記載の方法。

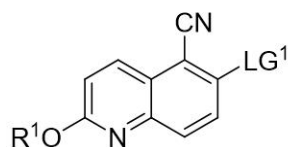
【請求項 28】

塩基が LiOtBu である、請求項 27 に記載の方法。

【請求項 29】

式 1-7 の化合物が、式 1-5 :

【化 9】



1-5

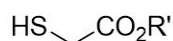
〔式中：

LG¹ は適切な脱離基であり；および

R¹ は適切な酸素保護基である〕

で示される化合物またはその塩を、式 1-6：

【化 10】



1-6

の化合物と、適切な反応条件下で反応させて、式 1-7 の化合物の化合物を得ることを含むプロセスによって製造される、請求項 21-28 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 30】

LG¹ がハロゲンである、請求項 29 に記載の方法。

【請求項 31】

LG¹ がブロミドである、請求項 30 に記載の方法。

【請求項 32】

R¹ がベンジルである、請求項 29-31 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 33】

R' が C₁-₆ 脂肪族基である、請求項 29-32 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 34】

R' がメチルである、請求項 33 に記載の方法。

【請求項 35】

反応条件が塩基を含む、請求項 29-34 のいずれか一項に記載の方法。

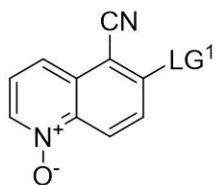
【請求項 36】

塩基が NaOMe である、請求項 35 に記載の方法。

【請求項 37】

式 1-5 の化合物が、式 1-4：

【化 11】



1-4

の化合物またはその塩を、式：R¹OH の化合物と、適切な反応条件下で反応させて、式 1-5 の化合物またはその塩を得ることを含むプロセスによって製造される、請求項 29-36 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 38】

LG¹ がハロゲンである、請求項 37 に記載の方法。

【請求項 39】

LG¹ がブロミドである、請求項 38 に記載の方法。

【請求項 40】

R¹ がベンジルである、請求項 37-39 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 41】

反応条件が塩基を含む、請求項 37-40 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 42】

塩基が DIEA である、請求項 41 に記載の方法。

【請求項 43】

反応条件が活性化化合物を含む、請求項 36-42 のいずれか一項に記載の方法。

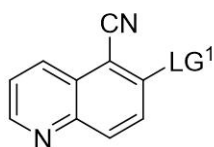
【請求項 44】

活性化化合物が p-トルエンスルホン酸無水物である、請求項 43 に記載の方法。

【請求項 45】

式 1-4 の化合物が、式 1-3 :

【化 12】



1-3

の化合物またはその塩を、適切な反応条件下で反応させて、式 1-4 の化合物またはその塩を得ることを含むプロセスによって製造される、請求項 37-44 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 46】

LG¹ がハロゲンである、請求項 45 に記載の方法。

【請求項 47】

LG¹ がプロミドである、請求項 46 に記載の方法。

【請求項 48】

反応条件が過酸化試薬を含む、請求項 45-47 のいずれか一項に記載の方法。

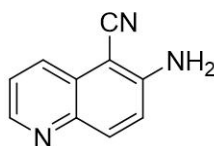
【請求項 49】

過酸化試薬が mCPBA である、請求項 48 に記載の方法。

【請求項 50】

式 1-3 の化合物が、式 1-2 :

【化 13】



1-2

の化合物またはその塩を、適切な反応条件下で反応させて、式 1-3 の化合物またはその塩を得ることを含むプロセスによって製造される、請求項 45-49 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 51】

反応条件が亜硝酸化合物を含む、請求項 50 に記載の方法。

【請求項 52】

亜硝酸化合物が亜硝酸tert-ブチルである、請求項 51 に記載の方法。

【請求項 53】

反応条件がさらにプロミド供給源を含む、請求項 50-52 のいずれか一項に記載の方法。

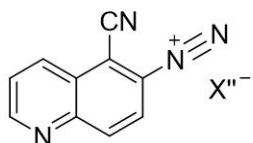
【請求項 54】

プロミド供給源が CuBr_2 である、請求項 53 に記載の方法。

【請求項 55】

反応条件が、式 1-2a：

【化 14】



1-2a

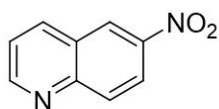
〔式中、X' ' は対イオンである〕

で示されるジアゾニウム中間体を系内にて形成することを含む、請求項 50-54 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 56】

式 1-2 の化合物が、式 1-1：

【化 15】



1-1

の化合物またはその塩を、適切な反応条件下で反応させて、式 1-2 の化合物またはその塩を得ることを含むプロセスによって製造される、請求項 50-55 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 57】

反応条件がシアン化剤を含む、請求項 56 に記載の方法。

【請求項 58】

シアン化剤がシアノ酢酸エチルである、請求項 57 に記載の方法。

【請求項 59】

反応条件がさらに塩基を含む、請求項 56-58 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 60】

塩基が DBU である、請求項 59 に記載の方法。

【請求項 61】

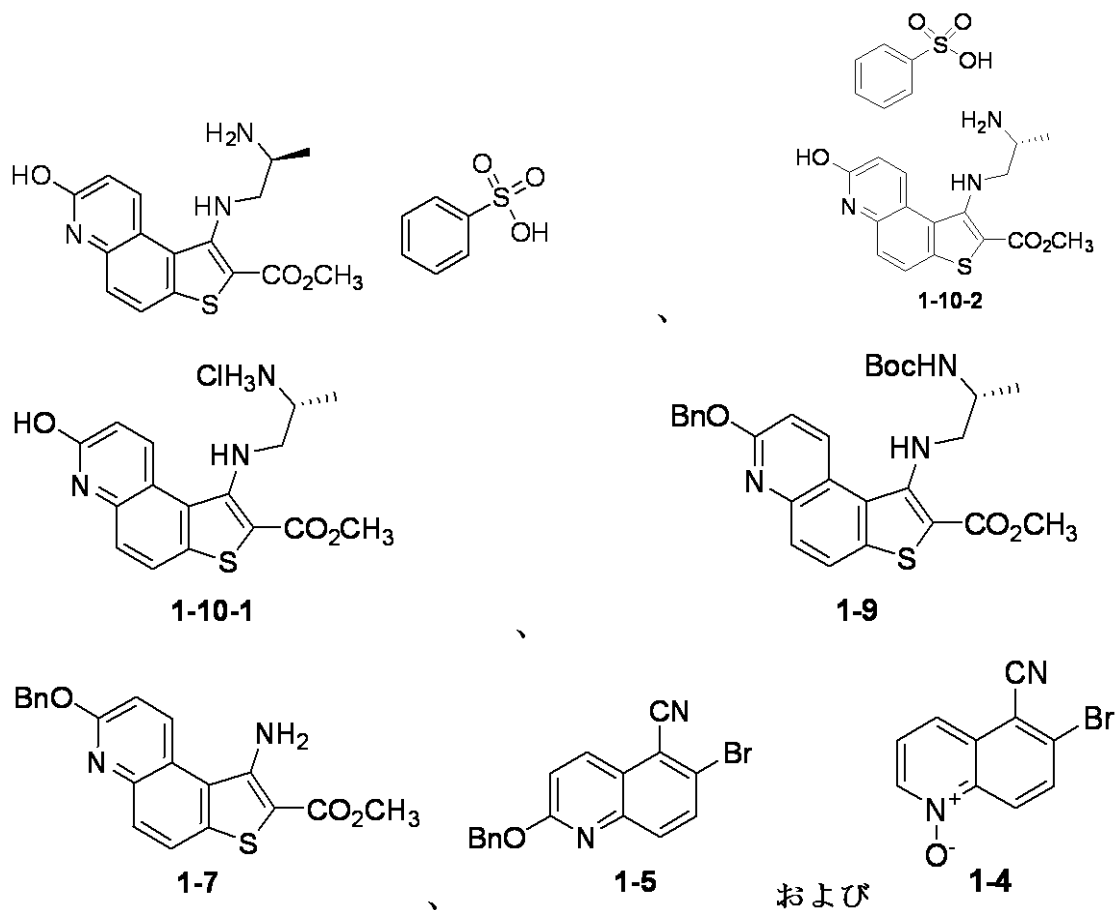
反応条件がさらに酸を含む、請求項 56-60 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 62】

酸が HCl である、請求項 61 に記載の方法。

【請求項 63】

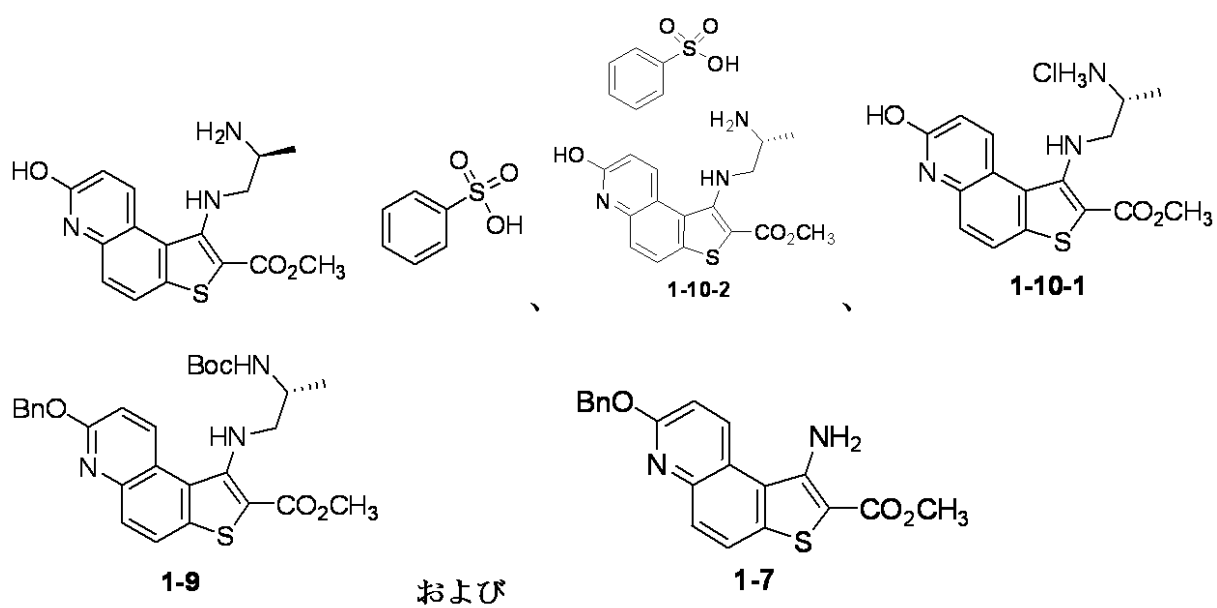
【化 1 6】



からなる群から選択される、化合物またはその塩。

【請求項 6 4】

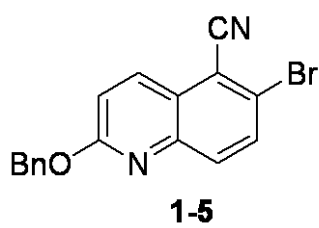
【化 1 7】



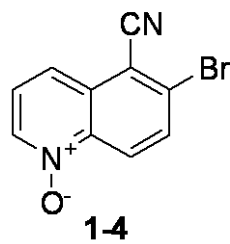
からなる群から選択される、請求項 6 3 記載の化合物またはその塩。

【請求項 6 5】

【化 1 8】



および



からなる群から選択される、請求項 6 3 記載の化合物またはその塩。