

【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9月5日(2023.9.5)

【公開番号】特開2023-112696(P2023-112696A)

【公開日】令和5年8月14日(2023.8.14)

【年通号数】公開公報(特許)2023-151

【出願番号】特願2023-13779(P2023-13779)

【国際特許分類】

C 0 7 D 4 9 1 / 0 5 2 (2 0 0 6 . 0 1)

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

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

10

【F I】

C 0 7 D 4 9 1 / 0 5 2 C S P

A 6 1 K 3 1 / 4 3 6

A 6 1 P 3 5 / 0 0

【手続補正書】

【提出日】令和5年8月28日(2023.8.28)

【手続補正1】

20

【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

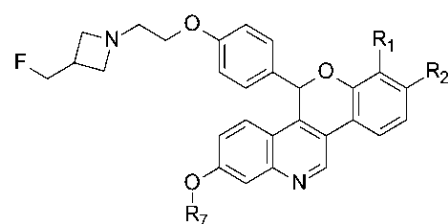
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式Aの化合物：

【化1】



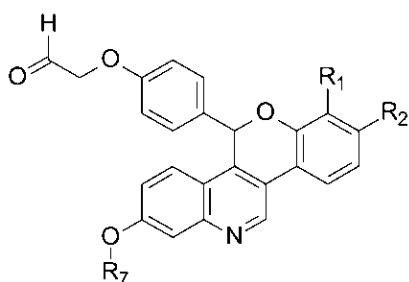
A

30

又はその薬学的に許容される塩を製造するための方法であって、式中、R₁又はR₂のいずれかが、独立して、Cl、F、-CF₃、又は-CH₃であり、他方が、Hであり、R₇が、H又はPGであり、前記方法が、構造8の化合物：

【化2】

40



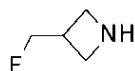
8

又はその塩（式中、R₇が、PG又はHであり、PGが、アルコール保護基である）を

50

、溶媒中で、構造 9 のアミン、

【化 3】



9

又はその塩、及び還元剤と反応させることを含む、方法。

【請求項 2】

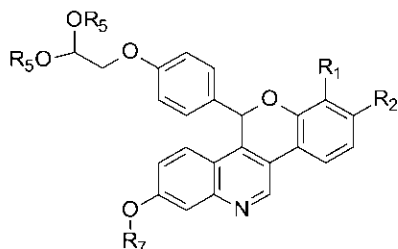
前記還元剤が、STAB、LiBH₄、NaBH₄、NaBH₃CN、又はピリジンボランである、請求項 1 に記載の方法。

10

【請求項 3】

構造 8 の化合物又はその塩を調製することを含み、構造 7 の化合物を、

【化 4】



7

20

酸と反応させることを含み、各 R₅ が、独立して、C₁ ~ C₆ アルキルであるか、又は 2 つの R₅ 基が一緒になって、-CH₂CH₂- 又は -CH₂CH₂CH₂- である、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 4】

前記酸が、HCl、H₂SO₄、p-TsOH、メタンスルホン酸、トリフルオロメタンスルホン酸、酢酸、又はトリクロロ酢酸を含む、請求項 3 に記載の方法。

【請求項 5】

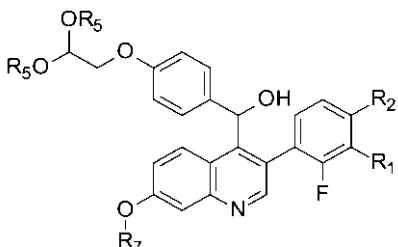
前記反応が、溶媒中で実施され、前記溶媒が、水を含む、請求項 3 に記載の方法。

【請求項 6】

30

構造 7 の化合物又はその塩を調製することを含み、構造 6 の化合物を、

【化 5】



6

40

塩基と反応させることを含む、請求項 3 に記載の方法。

【請求項 7】

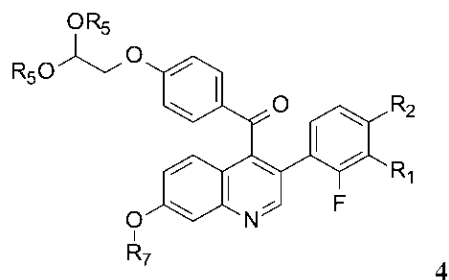
前記塩基が、Cs₂CO₃、NaH、ナトリウムtert-ブトキシド、NaOH、LiOH、KOH、ナトリウムtert-ペントキシド、カリウムtert-ペントキシド、又はDBUを含む、請求項 6 に記載の方法。

【請求項 8】

構造 6 の化合物又はその塩を調製することを含み、構造 4 の化合物を、

50

【化 6】



還元剤と反応させることを含む、請求項 6 に記載の方法。

10

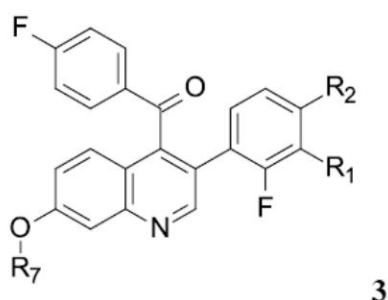
【請求項 9】

還元剤が、 LiAlH_4 、 NaBH_4 、又はボランリガンドを含み、前記リガンドが、 THF 、 Me_2S 、カテコール、又は N,N -ジエチルアニリンである、請求項 8 に記載の方法。

【請求項 10】

構造 4 の化合物又はその塩を調製することを含み、構造 3 の化合物を、

【化 7】



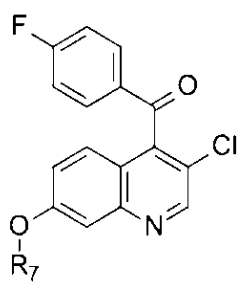
20

$\text{HOCH}_2\text{CH}(\text{OR}_5)_2$ と反応させることを含む、請求項 8 に記載の方法。

【請求項 11】

構造 3 の化合物又はその塩を調製することを含み、構造 1 の化合物と、

【化 8】

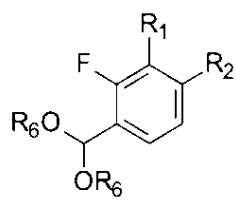


30

構造 2 の化合物との間のクロスカップリング反応を含み、

40

【化 9】



式中、 R_6 が、水素若しくはアルキル、又は 2 つの R_6 基が少なくとも 2 つの炭素によって接合されて、触媒の存在下でジオキサボロラン又はジオキサボリナンを形成する構造

50

であり得る、請求項 10 に記載の方法。

【請求項 12】

前記触媒が、遷移金属触媒を含む、請求項 11 に記載の方法。

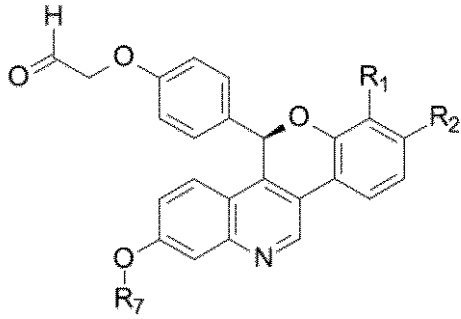
【請求項 13】

前記遷移金属触媒が、Pd 触媒を含む、請求項 12 に記載の方法。

【請求項 14】

前記構造 8 の化合物が、構造 8B の化合物である、請求項 1 に記載の方法。

【化 10】



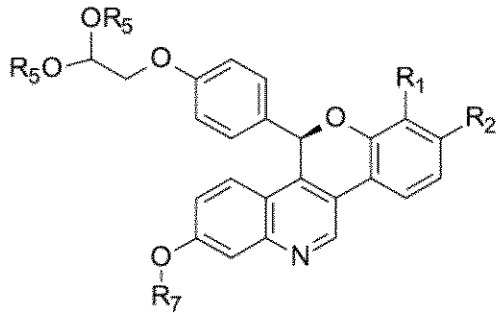
8B

10

【請求項 15】

前記構造 7 の化合物が、構造 7B の化合物である、請求項 3 に記載の方法。

【化 11】



7B

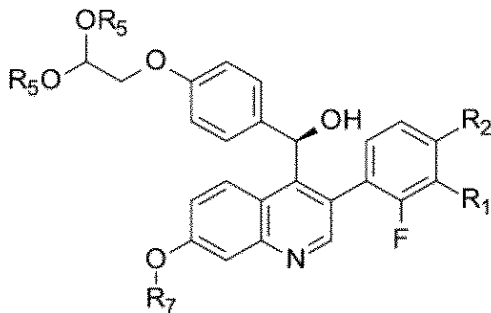
20

30

【請求項 16】

前記構造 6 の化合物が、構造 6B の化合物である、請求項 6 に記載の方法。

【化 12】



6B

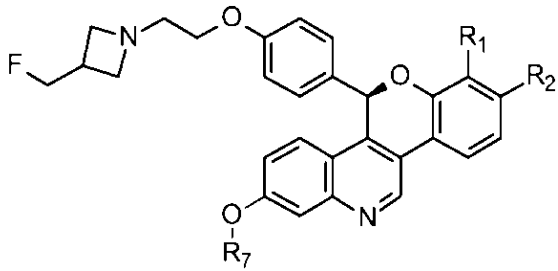
40

【請求項 17】

前記式 A の化合物又はその薬学的に許容される塩が、式 B の化合物、

50

【化 1 3】



B

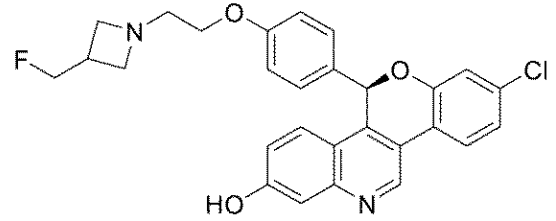
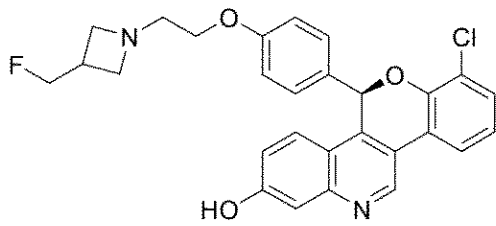
10

又はその薬学的に許容される塩であり、式中、 R_1 又は R_2 のいずれかが、独立して、 Cl 、 F 、 $-CF_3$ 、又は $-CH_3$ であり、他方が、 H であり、 R_7 が、 H 又は PG である、請求項 1 に記載の方法。

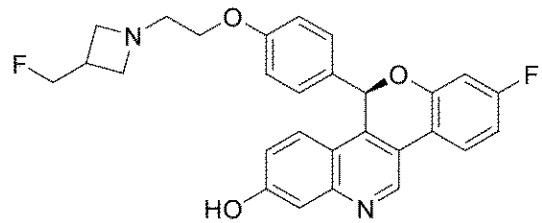
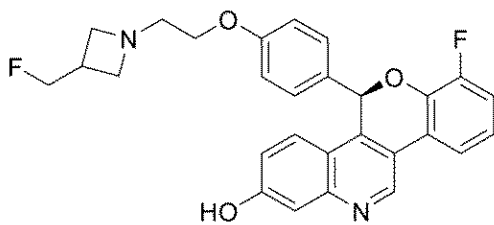
【請求項 1 8】

前記化合物又はその薬学的に許容される塩が、以下から選択される、請求項 1 4 ~ 1 7 のいずれか一項に記載の方法。

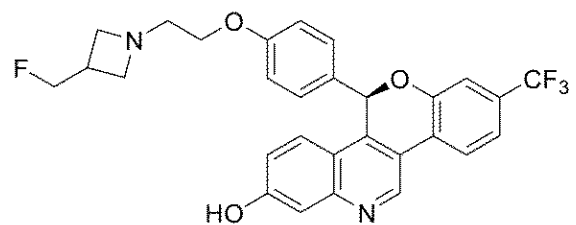
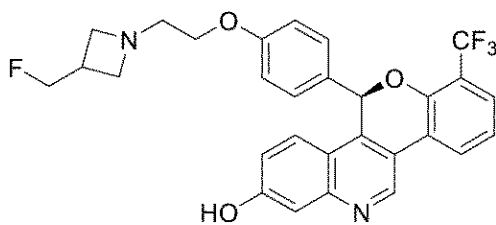
【化 1 4】



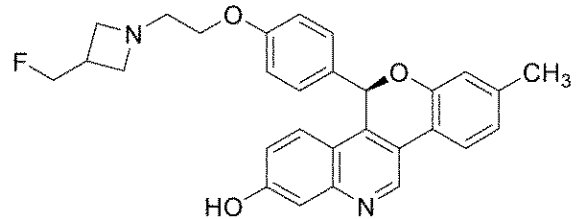
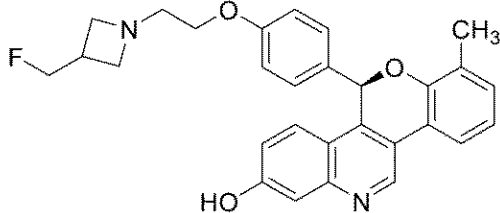
20



30



40



及び

【請求項 1 9】

前記化合物が、トシレート塩として提供される、請求項 1 8 に記載の方法。

【請求項 2 0】

(R) - 2 - (4 - (2 - ヒドロキシ - 8 - (トリフルオロメチル) - 5 H - クロメノ [4 , 3 - c] キノリン - 5 - イル) フェノキシ) エタン - 1 , 1 - ジオールである、化

50

合物、又はその塩。

【請求項 21】

(R) - 2 - (4 - (2 - ヒドロキシ - 8 - (トリフルオロメチル) - 5 H - クロメノ
[4 , 3 - c] キノリン - 5 - イル) フェノキシ) エタン - 1 , 1 - ジオールである、化
合物。

10

20

30

40

50