

【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 4 年 7 月 1 日 (2022.7.1)

【国際公開番号】WO2020/009132

【出願番号】特願 2020-529019 (P2020-529019)

【国際特許分類】

C 0 7 D 3 1 9 / 1 2 (2006.01)

C 0 7 D 4 0 5 / 1 4 (2006.01)

C 0 7 D 4 0 5 / 1 2 (2006.01)

10

【F I】

C 0 7 D 3 1 9 / 1 2

C 0 7 D 4 0 5 / 1 4

C 0 7 D 4 0 5 / 1 2

【手続補正書】

【提出日】令和 4 年 6 月 23 日 (2022.6.23)

【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

20

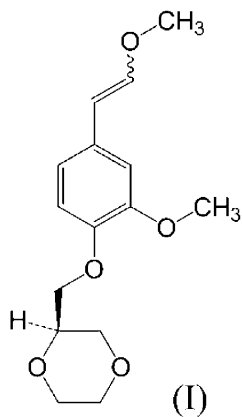
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) ；



30

で示される化合物を、塩素化剤およびジメチルホルムアミドと反応させ、

式 (II) ；

40



20

塩素化剤が、塩化オキザリルである、請求項 1 に記載の方法。

塩基存在下、式(II)で示される化合物またはその塩を

式 (I I I) :



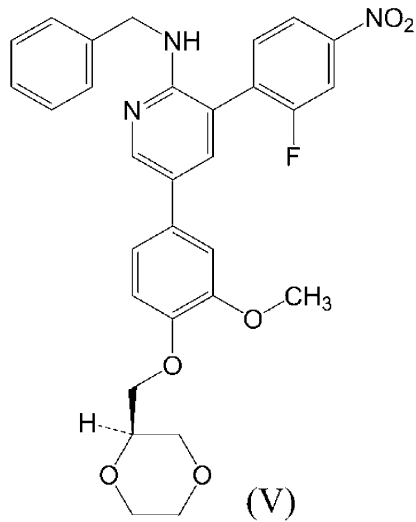
式 (I V)

【請求項4】

塩基が 2, 6 - ルチジンである、請求項 3 に記載の方法。

式 (I V) で示される化合物またはその塩をベンジルアミンと反応させ、

式 (V) :



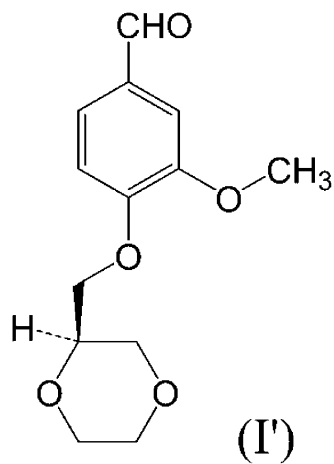
10

で示される化合物又はその塩を得ることをさらに包含する、請求項 3 または 4 に記載の方法。

【請求項 6】

(i) 式 (I') :

20

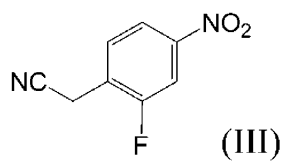


30

で示される化合物を W i t t i g 試薬と反応させる工程、

(i i) 工程 (i) で得られた化合物を塩素化剤およびジメチルホルムアミドと反応させる工程、

(i i i) 工程 (i i) で得られた化合物を塩基存在下、式 (I I I) :

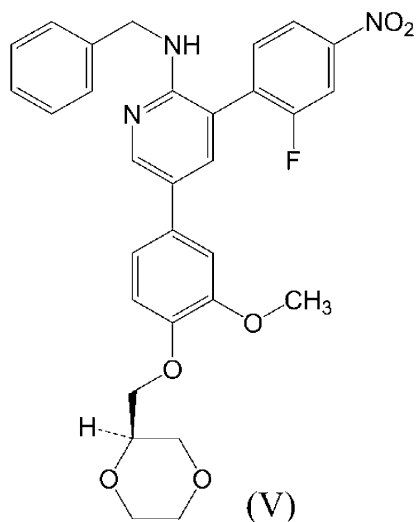


40

で示される化合物と反応させる工程、および

(i v) 工程 (i i i) で得られた化合物をベンジルアミンと反応させ、式 (V) :

50



10

で示される化合物又はその塩を得る工程を包含する製造方法。

【請求項 7】

工程 (i) における Wittig 試薬が、 $\text{Ph}_3\text{P}(\text{Cl})\text{CH}_2\text{OMe}$ である、請求項 6 に記載の方法。

20

【請求項 8】

工程 (ii) における塩素化剤が、塩化オキザリルである、請求項 6 または 7 に記載の方法。

【請求項 9】

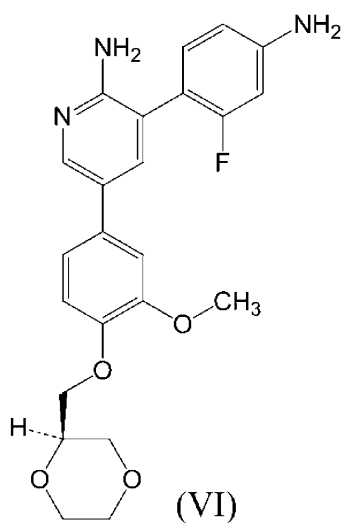
工程 (iii) における塩基が、2, 6 - ルチジンである、請求項 6 から 8 のいずれか 1 項に記載の方法。

【請求項 10】

溶媒中、パラジウム炭素触媒存在下、式 (V) で示される化合物またはその塩を水素と反応させ、

式 (VI) を得る。

30



40

で示される化合物またはその塩を得ることをさらに包含する、請求項 5 から 9 のいずれか 1 項に記載の方法。

【請求項 11】

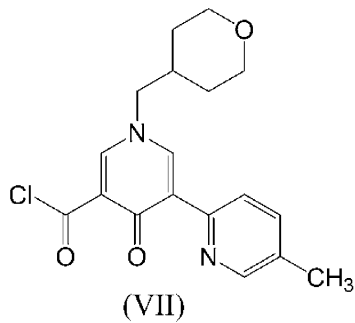
式 (V) で示される化合物またはその塩が、式 (V) で示される化合物の塩酸塩であり、

50

溶媒が、１－プロパノールまたはＮ－メチルピロリドンである、請求項１０に記載の方法。

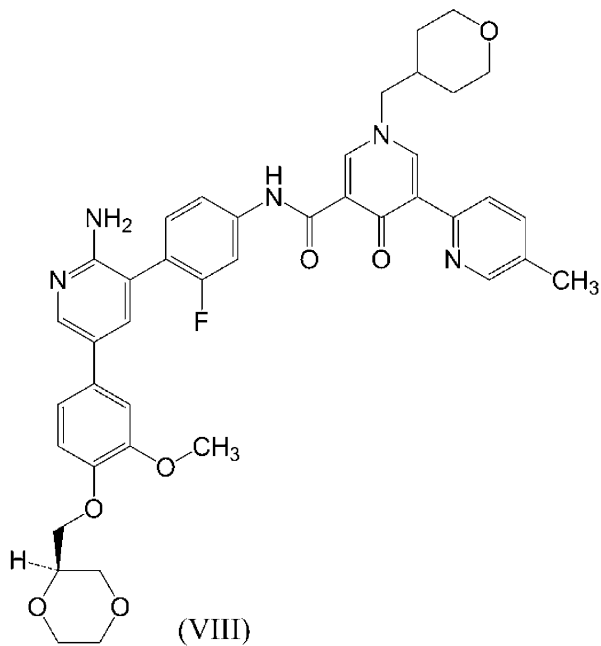
【請求項１２】

式（ＶＩ）で示される化合物を式（ＶＩＩ）：



10

で示される化合物またはその塩と縮合させ、
式（ＶＩＩＩ）：



20

30

で示される化合物またはその塩を得ることをさらに包含する、請求項１０または１１に記載の方法。

【請求項１３】

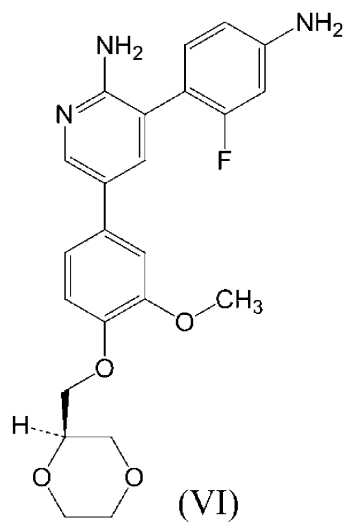
式（ＶＩＩＩ）で示される化合物またはその塩が、式（ＶＩＩＩ）で示される化合物の硫酸塩である、請求項１２に記載の方法。

40

【請求項１４】

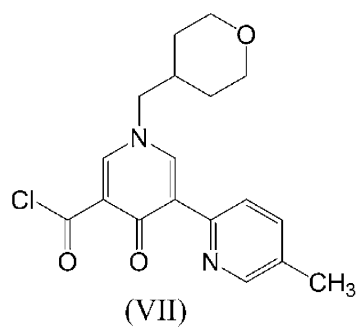
式（ＶＩ）：

50



10

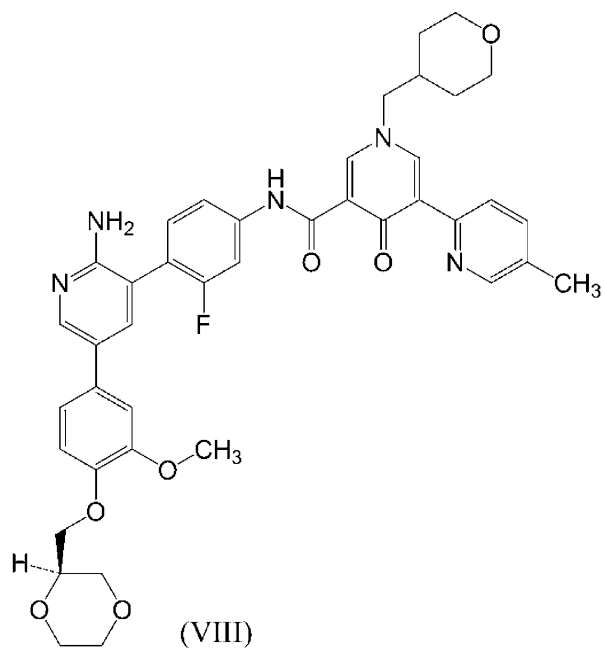
で示される化合物またはその塩を
式 (VII) :



20

で示される化合物またはその塩と反応させ、
式 (VIII) :

30



40

で示される化合物またはその塩を得ることを包含する製造方法。

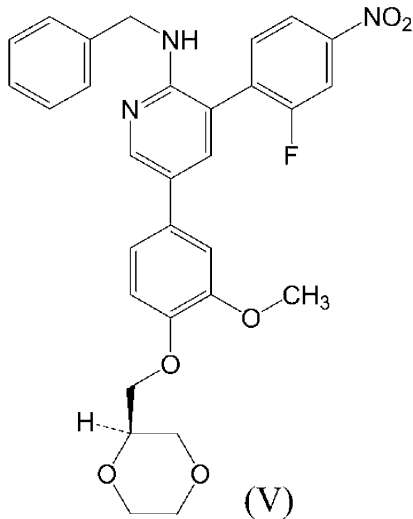
50

【請求項 15】

式(VIII)で示される化合物またはその塩が、式(VIII)で示される化合物の硫酸塩である、請求項14に記載の方法。

【請求項 16】

溶媒中、式(V)：



10

20

で示される化合物又はその塩を水素と反応させ、式(VI)で示される化合物またはその塩を得ることを包含する請求項14または15に記載の方法。

【請求項 17】

式(V)で示される化合物またはその塩が、式(V)で示される化合物の塩酸塩であり、溶媒が、1-プロパノールまたはN-メチルピロリドンである、請求項16に記載の方法。

【請求項 18】

式(V)で示される化合物またはその塩を水素と反応させることが、パラジウム炭素触媒存在下で行われる、請求項16または17に記載の方法。

30

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0030

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0030】

で示される化合物をWittig試薬と反応させる工程、

(ii)工程(i)で得られた化合物を塩素化剤およびジメチルホルムアミドと反応させる工程、

(iii)工程(ii)で得られた化合物を塩基存在下、上記式(III)で示される化合物と反応させる工程、および

(iv)工程(iii)で得られた化合物をベンジルアミンと反応させる工程を包含する、上記式(V)で示される化合物又はその塩の製造方法。

40

(7)工程(i)におけるWittig試薬が、 $\text{Ph}_3\text{P}(\text{Cl})\text{CH}_2\text{OMe}$ である、(6)に記載の方法。

【手続補正3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0051

【補正方法】変更

【補正の内容】

50

【 0 0 5 1 】

本発明において、「W i t t i g 試薬」とは、アルデヒドおよびケトンと反応し、炭素 - 炭素二重結合を構築することができる試薬を意味する。二重結合にアルコキシ基が置換した化合物を得ることができるW i t t i g 試薬が好ましい。例えば、 $\text{Ph}_3\text{P}(\text{Cl})\text{CH}_2\text{OMe}$ 、 $\text{Ph}_3\text{P}(\text{Br})\text{CH}_2\text{OMe}$ および $\text{Ph}_3\text{P}(\text{I})\text{CH}_2\text{OMe}$ 等が挙げられる。

10

20

30

40

50