

(12) 特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局

(43) 国際公開日
2012 年 10 月 4 日(04.10.2012)



(10) 国際公開番号

WO 2012/133416 A1

- (51) 国際特許分類:
C07D 401/12 (2006.01) A61K 31/496 (2006.01)
C07D 401/14 (2006.01)
- (21) 国際出願番号: PCT/JP2012/057949
- (22) 国際出願日: 2012 年 3 月 27 日(27.03.2012)
- (25) 国際出願の言語: 日本語
- (26) 国際公開の言語: 日本語
- (30) 優先権データ:
特願 2011-072231 2011 年 3 月 29 日(29.03.2011) JP
- (71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): エーザイ・アール・アンド・ディー・マネジメント株式会社 (Eisai R&D Management Co., Ltd.) [JP/JP]; 〒1128088 東京都文京区小石川四丁目 6 番 10 号 Tokyo (JP).
- (72) 発明者; および
- (75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 高橋 正史 (TAKAHASHI MASABUMI) [JP/JP]; 〒3140255 茨城県神栖市砂山 2 2 番地 エーザイ株式会社 鹿島事業所内 Ibaraki (JP).
- (74) 代理人: 長谷川 芳樹, 外 (HASEGAWA Yoshiki et al.); 〒1000005 東京都千代田区丸の内二丁目 1 番 1 号丸の内 MY PLAZA (明治安田生命

ビル) 9 階 創英国際特許法律事務所 Tokyo (JP).

- (81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

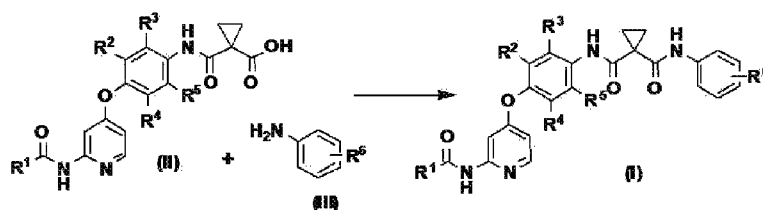
- (84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

— 国際調査報告 (条約第 21 条(3))

(54) Title: METHOD FOR PRODUCING PHENOXYPYRIDINE DERIVATIVE

(54) 発明の名称: フェノキシピリジン誘導体の製造方法 (3)



(57) Abstract: Disclosed is a method for producing a compound represented by formula (I), or a salt thereof, the method being characterized in that a compound represented by formula (II), or a salt thereof, is reacted with an aniline derivative represented by formula (III), in water or in a mixed solvent of water and an organic solvent, in the presence of 1-ethyl-3-(3-dimethylaminopropyl) carbodiimide and substantially in the absence of a base. (In the formulas, R¹ is a 4-[3-(dimethylamino)azetidin-1-yl]piperidin-1-yl group, a 4-(4-methylpiperazin-1-yl)piperidin-1-yl group, a 3-hydroxyazetidin-1-yl group, or a methyl(1-methylpiperidin-4-yl)amino group; R², R³, R⁴, and R⁵ are each identical or different and signify a hydrogen atom or a fluorine atom; and R⁶ signifies a hydrogen atom or a halogen atom.)

(57) 要約: 式 (I) で表される化合物またはその塩と、式 (III) で表されるアニリン誘導体とを、水中または水と有機溶媒の混合溶媒中、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミドの存在下かつ実質的に塩基非存在下で反応させることを特徴とする、式 (I) で表される化合物またはその塩の製造方法を開示する。[式中、R¹は4-[3-(ジメチルアミノ)アゼチジン-1-イル]ピペリジン-1-イル基、4-(4-メチルピペラジン-1-イル)ピペリジン-1-イル基、3-ヒドロキシアゼチジン-1-イル基またはメチル(1-メチルピペリジン-4-イル)アミノ基であり、R²、R³、R⁴およびR⁵はそれぞれ同一または相異なって、水素原子またはフッ素原子を意味し、R⁶は水素原子またはハロゲン原子を意味する。]

WO 2012/133416 A1