

(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3月1日(01.03.2012)

PCT

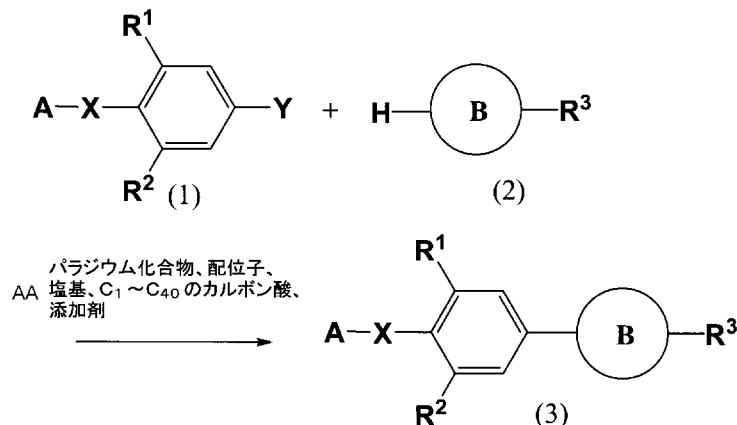
(10) 国際公開番号
WO 2012/026565 A1

- (51) 国際特許分類:
C07D 277/20 (2006.01) A61P 19/06 (2006.01)
C07D 277/56 (2006.01) A61P 43/00 (2006.01)
A61K 31/426 (2006.01)
- (21) 国際出願番号: PCT/JP2011/069250
- (22) 国際出願日: 2011年8月26日(26.08.2011)
- (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 2010-190760 2010年8月27日(27.08.2010) JP
- (71) 出願人(米国を除く全ての指定国について): 帝人ファーマ株式会社(TEIJIN PHARMA LIMITED) [JP/JP]; 〒1000013 東京都千代田区霞が関三丁目2番1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): 小宮山 真人(KOMIYAMA, Masato) [JP/JP]; 〒1910065 東京都日野市旭が丘四丁目3番2号 帝人ファーマ株式会社 東京研究センター内 Tokyo (JP).
- (74) 代理人: 為山 太郎(TAMEYAMA, Taro); 〒1000013 東京都千代田区霞が関三丁目2番1号 株式会社帝人知的財産センター内 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, 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, 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

[続葉有]

(54) Title: METHOD FOR PRODUCING PHENYL-SUBSTITUTED HETEROCYCLIC DERIVATIVE BY MEANS OF COUPLING METHOD USING A PALLADIUM COMPOUND

(54) 発明の名称: パラジウム化合物を用いたカップリング法によるフェニル置換複素環誘導体の製造法



(57) Abstract: The present invention provides a method for producing a xanthine oxidase inhibitor, which is a therapeutic agent for hyperuricemia, or intermediates of the same, said method being efficient and using a short-procedure. The present invention is a novel coupling method for obtaining a compound represented by formula (3) by bringing about a coupling reaction between a compound represented by formula (1) and a compound represented by formula (2), in the presence of a palladium compound, a ligand obtained by coordination in a palladium compound, a base, a C₁-C₄₀ carboxylic acid, and at least one kind of additive.

(57) 要約: 本発明の課題は、高尿酸血症の治療薬であるキサンチンオキシダーゼ阻害剤又はその中間体の、短工程の効率的な製造法を提供することである。本発明は、式(1)で表される化合物と式(2)で表される化合物とを、パラジウム化合物、パラジウム化合物に配位し得る配位子、塩基、及び及びC₁~C₄₀のカルボン酸、さらに1種類以上の添加剤の存在下でカップリング反応させることによる、式(3)で表される化合物を得る新規のカップリング法である。



WO 2012/026565 A1

WO 2012/026565 A1



(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))