

(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
2015年9月17日(17.09.2015)



(10) 国際公開番号
WO 2015/137408 A1

- (51) 国際特許分類:
C07D 333/40 (2006.01) **C07D 333/38** (2006.01)
- (21) 国際出願番号: PCT/JP2015/057178
- (22) 国際出願日: 2015年3月11日(11.03.2015)
- (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 2014-048091 2014年3月11日(11.03.2014) JP
- (71) 出願人: 味の素株式会社(AJINOMOTO CO., INC.)
[JP/JP]; 〒1048315 東京都中央区京橋一丁目1番1号 Tokyo (JP).
- (72) 発明者: 高下 隆太(TAKASHITA, Ryuta); 〒2108681 神奈川県川崎市川崎区鈴木町1-1
味の素製薬株式会社内 Kanagawa (JP).
- (74) 代理人: 高島 一(TAKASHIMA, Hajime); 〒5410044 大阪府大阪市中央区伏見町四丁目1番1号 明治安田生命大阪御堂筋ビル Osaka (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, BN, 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, IR, IS, JP, KE, KG, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SA, 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.

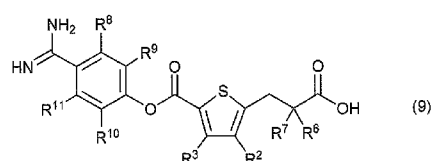
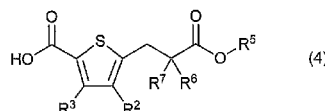
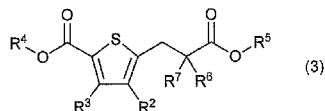
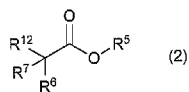
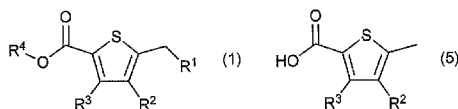
- (84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, ST, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーロアジア (AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK,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

(54) 発明の名称: ヘテロアリアルカルボン酸エステル誘導体の製造方法及びその製造中間体



(57) Abstract: Provided are a method for producing a compound (9) useful as a drug for the treatment of diabetes, and a production intermediate thereof. (a) A diester (3) is synthesized by reacting a compound (1) and a compound (2), (b) an ester (4) is synthesized by deprotecting the diester (3) (or an ester (4) is synthesized by reacting a compound (5) and the compound (2)), (c) the ester (4) is converted into an acid halide, (d) the acid halide is reacted with an amidinophenol derivative, and (e) the resulting diester derivative is deprotected under acidic conditions and converted into compound (9) (in the formula, R¹ represents a halogen atom, R⁴ represents a lower alkyl group, R⁵ represents a lower alkyl group, and R¹² represents a hydrogen atom or a halogen atom).

(57) 要約: 糖尿病治療薬として有用な化合物(9)の製造方法およびその製造中間体の提供。(a)化合物(1)と化合物(2)との反応により、ジエステル(3)を合成し、(b)ジエステル(3)の脱保護により、エステル(4)を合成し(又は化合物(5)と化合物(2)との反応によりエステル(4)を合成し)、(c)エステル(4)を酸ハライドに変換し、(d)酸ハライドをアミジノフェノール誘導体と反応させ、(e)得られたジエステル誘導体を酸性条件にて脱保護し、化合物(9)へと変換する(式中、R¹はハロゲン原子、R⁴は低級アルキル基、R⁵は低級アルキル基、R¹²は水素原子又はハロゲン原子を表す)。