

(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 2015/137407 A1

- (51) 国際特許分類:
C07D 333/40 (2006.01)
- (21) 国際出願番号: PCT/JP2015/057177
- (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 2014-048019 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5号 Tokyo (JP).
- (72) 発明者: 山田 竜大(YAMADA, Tatsuhiko); 〒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). 多々良 明訓(TATARA, Akinori); 〒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). 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). 小玉 りほ(KODAMA, Riho); 〒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). 大熊 一貴(OOKUMA, Kazutaka); 〒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).

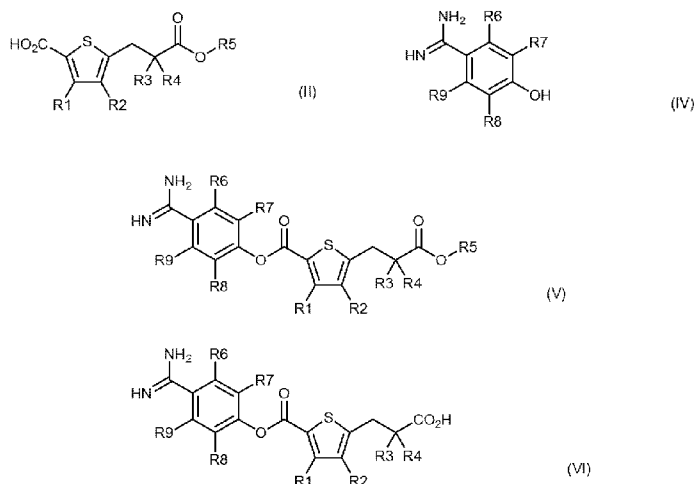
(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS, JP, KE, KG, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LU, LY, MA, MD, ME, MG, 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), ユーロピア (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,

[続葉有]

(54) Title: PRODUCTION METHOD FOR HETEROARYLCARBOXYLIC ACID ESTER DERIVATIVE, PRODUCTION INTERMEDIATE THEREOF, AND CRYSTAL

(54) 発明の名称: ヘテロアリールカルボン酸エステル誘導体の製造方法、その製造中間体及び結晶



(57) Abstract: Provided are a production method for a compound (VI) that is useful as a therapeutic agent for diabetes, a production intermediate thereof, and a crystal. The production method for the compound (VI) or a salt thereof includes: a step (d) in which a compound (II) is reacted with an acid halogenation agent and converted to an acid halide; a step (e) in which the acid halide is reacted with a compound (IV) in the presence of a base, and a compound (V) or a salt thereof is crystallized from the reaction system; and a step (f) in which, after the compound (V) is subjected to a reductive deprotection reaction in the presence of a metal catalyst, a compound (VI) or a salt thereof is crystallized from the reaction system (in the formula, R5 represents an aralkyl group that may include a substituent group, an aralkyl oxymethyl group that may include a substituent group, or a heteroaryl alkyl group that may include a substituent group).

(57) 要約:

[続葉有]

WO 2015/137407 A1



MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, 添付公開書類:
TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, — 国際調査報告 (条約第 21 条(3))
KM, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

糖尿病治療薬として有用な化合物(VI)の製造方法、その製造中間体、及び結晶の提供。(d)化合物(II)を酸ハロゲン化剤と反応させ、酸ハライドに変換する工程、(e)酸ハライドを塩基存在下、化合物(IV)と反応させ、反応系中から化合物(V)又はその塩を晶析する工程、(f)化合物(V)を金属触媒存在下、還元的脱保護反応を行った後、反応系中から化合物(VI)又はその塩を晶析する工程を含む、化合物(VI)又はその塩の製造方法(式中、R⁵は置換基を有してもよいアルキル基、置換基を有してもよいアルキルオキシメチル基、又は置換基を有してもよいヘテロアリーラルキル基を表す)。