

(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
2018年12月6日(06.12.2018)



(10) 国際公開番号

WO 2018/220533 A3

(51) 国際特許分類:
A61K 31/506 (2006.01) C07D 401/12 (2006.01)
A61P 35/00 (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/IB2018/053822

(22) 国際出願日: 2018年5月29日(29.05.2018)

(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 2017-106280 2017年5月30日(30.05.2017) JP

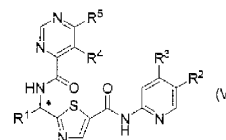
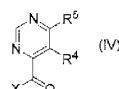
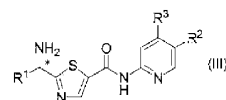
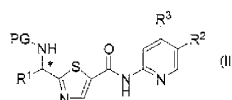
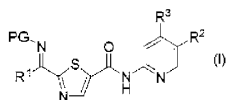
(71) 出願人: ミレニアム ファーマシュー
ーティカルズ, インコーポレイ
テッド(MILLENNIUM PHARMACEUTICALS,
INC.) [US/US]; 02139 マサチューセッツ 02
139, ケンブリッジ, ランズダウン ス
トリート 40 Massachusetts (US).

(72) 発明者: 平野 沙悠梨 (HIRANO, Sayuri);
〒532-0024 大阪府大阪市淀川区十三本町二

丁目17番85号 武田薬品工業株式会社
内 Osaka (JP). 武田 善行(TAKEDA, Yoshiyuki);
〒532-0024 大阪府大阪市淀川区十三本町二
丁目17番85号 武田薬品工業株式会社
内 Osaka (JP). 中本 幸治(NAKAMOTO, Koji);
〒532-0024 大阪府大阪市淀川区十三本町二丁目
17番85号 武田薬品工業株式会社内 Osaka
(JP). 池内 元樹(IKEUCHI, Motoki); 〒532-0024
大阪府大阪市淀川区十三本町二丁目17番8
5号 武田薬品工業株式会社内 Osaka (JP). 北
山 理乙(KITAYAMA, Masato); 〒532-0024 大阪
府大阪市淀川区十三本町二丁目17番85号
武田薬品工業株式会社内 Osaka (JP). 山田 雅
俊(YAMADA, Masatoshi); 〒532-0024 大阪府大
阪市淀川区十三本町二丁目17番85号 武
田薬品工業株式会社内 Osaka (JP). 川上 淳一
(KAWAKAMI, Jun-ichi); 〒532-0024 大阪府大
阪市淀川区十三本町二丁目17番85号 武
田薬品工業株式会社内 Osaka (JP).

(54) Title: METHOD FOR PRODUCING OPTICALLY ACTIVE COMPOUND

(54) 発明の名称: 光学活性化合物の製造法



(57) Abstract: Provided is a method for producing an optically active pyrimidine amide derivative that can be produced on an industrial scale. Compound (I), (V) or a salt thereof is subjected to an asymmetric reduction reaction, the obtained compound (II) or a salt thereof is subjected to a deprotection reaction, the obtained compound (III) or a salt thereof is reacted with compound (IV) or a salt thereof, and compound (V) or a salt thereof is obtained. (In the formulas, the symbols are as defined in the description.)

(57) 要約: 工業的規模で製造可能な光学活性なピリミジンアミド誘導体の製造方法を提供する。化合物 (I) (V) またはその塩を不斉還元反応に付し、得られる化合物 (II) またはその塩を脱保護反応に付し、得られる化合物 (III) またはその塩を化合物 (IV) またはその塩と反応させ、化合物 (V) またはその塩を得る。[式中の各記号は明細書に記載の通りである。]

[続葉有]

WO 2018/220533 A3



(74) 代理人: ゴールドバーグ, ジョシュア ビー.
(**GOLDBERG, Joshua B.**); 22314 ヴァージニア
2 2 3 1 4, アレキサンドリア, サウス ウェ
スト ストリート 1 1 2, ナス, ゴールドバ
ーグ アンド メイヤーズ Virginia (US).

(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, DJ, DK, DM, DO,
DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT,
HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS, JO, KE, KG, KH,
KN, KP, KR, KW, 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), ユーラシア (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))

(88) 国際調査報告の公開日:

2019年2月28日(28.02.2019)