

(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 3 月 19 日(19.03.2015)



(10) 国際公開番号

WO 2015/037587 A1

(51) 国際特許分類:

C07F 9/6561 (2006.01) A61P 25/28 (2006.01)
A61K 31/675 (2006.01) A61P 27/02 (2006.01)
C07D 487/04 (2006.01) A61P 27/06 (2006.01)
A61P 9/10 (2006.01) A61P 35/00 (2006.01)
A61P 11/00 (2006.01) A61P 35/02 (2006.01)
A61P 25/16 (2006.01) A61P 43/00 (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2014/073821

(22) 国際出願日: 2014 年 9 月 9 日(09.09.2014)

(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 2013-188361 2013 年 9 月 11 日(11.09.2013) JP

(71) 出願人: 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 MANAGE-
MENT CO., LTD.) [JP/JP]; 〒1128088 東京都文京区
小石川四丁目 6 番 10 号 Tokyo (JP). 株式会社 P
R I S M P h a r m a (PRISM PHARMA CO.,
LTD.) [JP/JP]; 〒2268510 神奈川県横浜市緑区長津
田町 4 2 5 9-3 Kanagawa (JP).

(72) 発明者: 磯村 峰孝 (ISOMURA Minetaka); 〒
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). 小坂 由紀
(KOSAKA Yuki); 〒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). 永井 光雄(NAGAI Mitsuo); 〒3002635
茨城県つくば市東光台 5 丁目 1 番地 3 エーザ
イ株式会社 筑波研究所内 Ibaraki (JP). 小田上
剛直(ODAGAMI Takenao); 〒2268510 神奈川県横
浜市緑区長津田町 4 2 5 9-3 株式会社 P R
I S M P h a r m a 内 Kanagawa (JP). 小路 弘

行(KOUJI Hiroyuki); 〒2268510 神奈川県横浜市緑
区長津田町 4 2 5 9-3 株式会社 P R I S M
P h a r m a 内 Kanagawa (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 M Y P L A Z A (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, 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
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))

(54) Title: METHOD OF PRODUCING PYRAZINO[2,1-c][1,2,4]TRIAZINE COMPOUND

(54) 発明の名称: ピラジノ [2, 1-c] [1, 2, 4] トリアジン化合物の製造方法

(57) Abstract: This method of producing 4-(((6S,9S)-1-(benzylcarbamoyl)-2,9-dimethyl-4,7-dioxo-8-(quinoline-8-ylmethyl) octahydro-1H-pyrazino[2,1-c][1,2,4]triazine-6-yl)methyl) phenyl dihydrogen phosphate involves a step for adding a reaction solution (1) comprising (6S,9S)-N-benzyl-6-(4-hydroxybenzyl)-2,9-dimethyl-4,7-dioxo-8-(quinoline-8-ylmethyl) octahydro-1H-pyrazino[2,1-c][1,2,4]triazine-1-carboxamide, triethylamine and a solvent to a reaction solution (2) comprising a phosphorylating agent and a solvent.

(57) 要約: (6S, 9S) - N - ベンジル - 6 - (4 - ヒドロキシベンジル) - 2, 9 - ジメチル - 4, 7 - ジオキソ - 8 - (キノリン - 8 - イルメチル) オクタヒドロ - 1H - ピラジノ [2, 1-c] [1, 2, 4] トリアジン - 1 - カルボキサミド、トリエチルアミン及び溶媒からなる反応液 1 を、リン酸化剤及び溶媒からなる反応液 2 に添加する工程を含む、4 - (((6S, 9S) - 1 - (ベンジルカルバモイル) - 2, 9 - ジメチル - 4, 7 - ジオキソ - 8 - (キノリン - 8 - イルメチル) オクタヒドロ - 1H - ピラジノ [2, 1-c] [1, 2, 4] トリアジン - 6 - イル) メチル) フェニル ジハイドロゲン フォスフェートの製造方法。

WO 2015/037587 A1