

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】平成28年6月30日(2016.6.30)

【公表番号】特表2015-520165(P2015-520165A)

【公表日】平成27年7月16日(2015.7.16)

【年通号数】公開・登録公報2015-045

【出願番号】特願2015-512903(P2015-512903)

【国際特許分類】

C 07 C 227/16 (2006.01)

C 07 C 229/34 (2006.01)

C 07 B 53/00 (2006.01)

C 07 B 61/00 (2006.01)

【F I】

C 07 C 227/16 C S P

C 07 C 229/34

C 07 B 53/00 B

C 07 B 61/00 3 0 0

【手続補正書】

【提出日】平成28年5月12日(2016.5.12)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

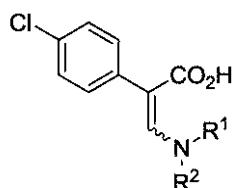
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式IIの化合物、またはその塩：

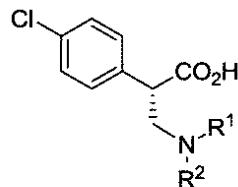
【化101】



I I

(式中、R<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>は独立して水素、C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>アルキルまたはアミノ保護基である)を還元して式Iの化合物、またはその塩：

【化102】



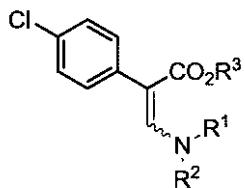
I

を形成させることを含むプロセス。

## 【請求項 2】

式 I I I の化合物、またはその塩：

## 【化 1 0 3】



I I I

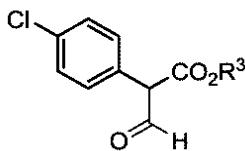
(式中、R<sup>3</sup>は任意で置換されたC<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>アルキルである)

を加水分解して式 I I の化合物またはその塩を形成させることをさらに含む、請求項 1 に記載のプロセス。

## 【請求項 3】

式 I V の化合物、またはその塩もしくは互変異性体：

## 【化 1 0 4】



I V

を、-NH R<sup>1</sup> R<sup>2</sup>またはその塩と反応させて式 I I I の化合物、またはその塩を形成させることをさらに含む、請求項 2 に記載のプロセス。

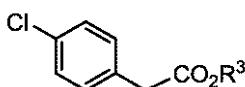
## 【請求項 4】

前記化合物-NH R<sup>1</sup> R<sup>2</sup>は-NH(イソプロピル)である、請求項 3 に記載のプロセス。

## 【請求項 5】

式 V の化合物またはその塩：

## 【化 1 0 5】



V

をHCO<sub>2</sub>R<sup>4</sup>(式中R<sup>4</sup>は任意で置換されたC<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>アルキルである)、またはその塩と、塩基性条件下で接触させて式 I V の化合物、またはその塩を形成させることをさらに含む、請求項 3 に記載のプロセス。

## 【請求項 6】

前記塩基性条件は水酸化物またはアルコキシド塩基から選択される塩基を含む、請求項 5 に記載のプロセス。

## 【請求項 7】

R<sup>1</sup>はアミノ保護基である、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載のプロセス。

## 【請求項 8】

前記アミノ保護基はアセチル、トリフルオロアセチル、フタルイミド、ベンジル、トリフェニルメチル、ベンジリデニル、p-トルエンスルホニル、p-メトキシベンジル、tert-ブチルオキシカルボニル、9-フルオレニルメチルオキシカルボニルおよびカルボベンジルオキシから選択される、請求項 1 ~ 7 のいずれか一項に記載のプロセス。

**【請求項 9】**

R<sup>1</sup>はtert-ブチルオキシカルボニルであり、かつR<sup>2</sup>はイソプロピルである、請求項1～8のいずれか一項に記載のプロセス。

**【請求項 10】**

前記還元することは式IIの化合物、またはその塩を金属触媒および水素ガスと接触させることを含む、請求項1～9のいずれか一項に記載のプロセス。

**【請求項 11】**

前記金属触媒はルテニウム、ロジウム、またはパラジウム触媒である、請求項10に記載のプロセス。

**【請求項 12】**

前記金属触媒は[ (S)-BINAPRuCl (ベンゼン) ]Clである、請求項10または請求項11に記載のプロセス。

**【請求項 13】**

R<sup>2</sup>はアミノ保護基である、請求項1～12のいずれか一項に記載のプロセス。

**【請求項 14】**

R<sup>2</sup>はC<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>アルキルである、請求項1～13のいずれか一項に記載のプロセス。

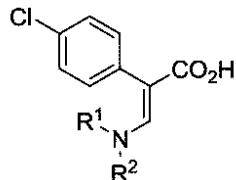
。

**【請求項 15】**

R<sup>2</sup>はイソプロピルである、請求項1～14のいずれか一項に記載のプロセス。

**【請求項 16】**

前記還元することは式IIbの化合物、またはその塩：

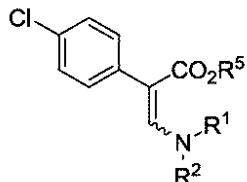
**【化106】**

II b

を還元して前記式Iの化合物またはその塩を形成させることを含む、請求項1～15のいずれか一項に記載のプロセス。

**【請求項 17】**

式VIの化合物、またはその塩であって、

**【化107】**

VI

式中：

R<sup>1</sup>は、水素、アセチル、トリフルオロアセチル、フタルイミド、ベンジル、トリフェニルメチル、ベンジリデニル、p-メトキシベンジル、tert-ブチルオキシカルボニル、9-フルオレニルメチルオキシカルボニルまたはカルボベンジルオキシであり；

R<sup>2</sup>はC<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>アルキルであり；および

R<sup>5</sup>は水素またはC<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>アルキルである、

式VIの化合物またはその塩。

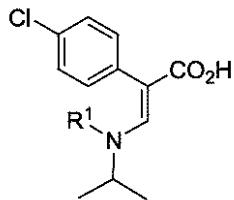
## 【請求項 1 8】

$R^1$  は水素であり； $R^2$  はイソプロピルであり；および $R^5$  は水素またはエチルである、請求項 1 7 に記載の化合物。

## 【請求項 1 9】

式 VI b またはその塩

## 【化 1 0 8】



VI b

(式中、 $R^1$  は水素または t - ブチルオキシカルボニル である)

を有する、請求項 1 7 に記載の化合物。

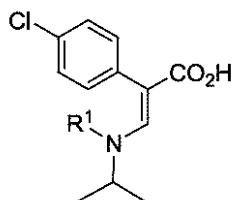
## 【請求項 2 0】

$R^1$  は t - ブチルオキシカルボニル である、請求項 1 7 または請求項 1 9 に記載の化合物。

## 【請求項 2 1】

式 VI b またはその塩であって、

## 【化 1 0 9】



VI b

式中、 $R^1$  は水素またはアミノ保護基である、

式 VI b またはその塩。

## 【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 0 1 1

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 1 1】

別の態様は、式 VI b を有する化合物またはその塩を含み：

## 【化 8】



VI b

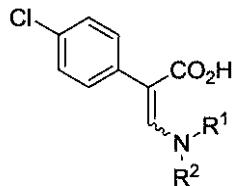
式中、 $R^1$  は本明細書で規定される。

本発明は、例えば、以下の項目も提供する。

(項目1)

式IIの化合物、またはその塩：

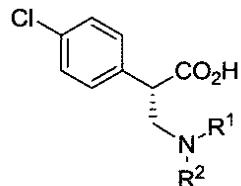
【化101】



II

(式中、R<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>は独立して水素、C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>アルキルまたはアミノ保護基である)を還元して式Iの化合物、またはその塩：

【化102】



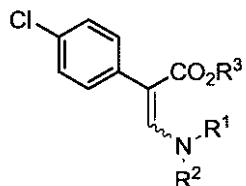
I

を形成させることを含むプロセス。

(項目2)

式IIIの化合物、またはその塩：

【化103】



III

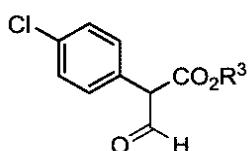
(式中、R<sup>3</sup>は任意で置換されたC<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>アルキルである)

を加水分解して式IIの化合物を形成させることをさらに含む、項目1に記載のプロセス。

(項目3)

式IVの化合物、またはその塩もしくは互変異性体：

【化104】



IV

を、-NHR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>またはその塩と反応させて式IIIの化合物、またはその塩を形成させることをさらに含む、項目1~2に記載のプロセス。

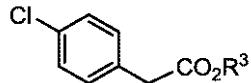
(項目4)

前記化合物 - N H R<sup>1</sup> R<sup>2</sup> は - N H (イソプロピル) である、項目3に記載のプロセス。

(項目5)

式Vの化合物またはその塩：

【化105】



V

を H C O , R<sup>4</sup> (式中 R<sup>4</sup> は任意で置換された C<sub>1</sub> - C<sub>12</sub> アルキルである)、またはその塩と、塩基性条件下で接触させて式IVの化合物、またはその塩を形成させることをさらに含む、項目1～3に記載のプロセス。

(項目6)

前記塩基性条件は水酸化物またはアルコキシド塩基から選択される塩基を含む、項目5に記載のプロセス。

(項目7)

R<sup>1</sup> はアミノ保護基である、項目1～6に記載のプロセス。

(項目8)

前記アミノ保護基はアセチル、トリフルオロアセチル、フタルイミド、ベンジル、トリフェニルメチル、ベンジリデニル、p - トルエンスルホニル、p - メトキシベンジル、tert - ブチルオキシカルボニル、9 - フルオレニルメチルオキシカルボニルおよびカルボベンジルオキシから選択される、項目1～7に記載のプロセス。

(項目9)

R<sup>1</sup> は tert - ブチルオキシカルボニルであり、かつ R<sup>2</sup> はイソプロピルである、項目1～8に記載のプロセス。

(項目10)

前記還元することは式IIの化合物、またはその塩を金属触媒および水素ガスと接触させることを含む、項目1～9に記載のプロセス。

(項目11)

前記金属触媒はルテニウム、ロジウム、またはパラジウム触媒である、項目1～10に記載のプロセス。

(項目12)

前記金属触媒は [ (S) - BINAPRuCl (ベンゼン) ] Cl である、項目1～11に記載のプロセス。

(項目13)

R<sup>2</sup> はアミノ保護基である、項目1～12に記載のプロセス。

(項目14)

R<sup>2</sup> は C<sub>1</sub> - C<sub>12</sub> アルキルである、項目1～13に記載のプロセス。

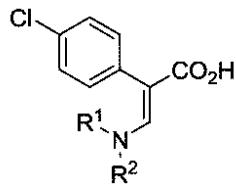
(項目15)

R<sup>2</sup> はイソプロピルである、項目1～14に記載のプロセス。

(項目16)

前記還元することは式IIbの化合物、またはその塩：

## 【化106】



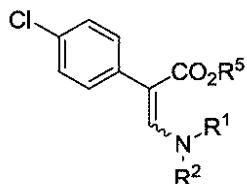
I I b

を還元して前記式 I の化合物またはその塩を形成させることを含む、項目 1 ~ 1 5 に記載のプロセス。

(項目17)

式 V I の化合物、またはその塩であつて、

【化107】



V I

式中：

R<sup>1</sup> および R<sup>2</sup> は独立して水素、C<sub>1</sub> - C<sub>12</sub> アルキルまたはアミノ保護基であり；ならびに

R<sup>5</sup> は水素または任意で置換されたC<sub>1</sub> - C<sub>12</sub> アルキルである、  
式 V I の化合物またはその塩。

(項目18)

R<sup>1</sup> は水素またはt-ブチルオキシカルボニルであり；R<sup>2</sup> はC<sub>1</sub> - C<sub>12</sub> アルキルであり；およびR<sup>5</sup> は水素またはC<sub>1</sub> - C<sub>12</sub> アルキルである、項目 1 7 に記載の化合物。

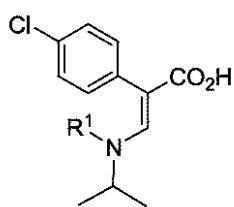
(項目19)

R<sup>1</sup> は水素であり；R<sup>2</sup> はイソプロピルであり；およびR<sup>5</sup> は水素またはエチルである、項目 1 7 ~ 1 8 に記載の化合物。

(項目20)

式 V I b またはその塩

【化108】



V I b

(式中、R<sup>1</sup> は水素またはアミノ保護基である)

を有する、項目 1 7 ~ 1 9 に記載の化合物。

(項目21)

R<sup>1</sup> はt-ブチルオキシカルボニルである、項目 1 7 ~ 2 0 に記載の化合物。