

【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29年9月7日(2017.9.7)

【公表番号】特表2016-530248(P2016-530248A)

【公表日】平成28年9月29日(2016.9.29)

【年通号数】公開・登録公報2016-057

【出願番号】特願2016-530446(P2016-530446)

【国際特許分類】

C 07 H 19/048 (2006.01)

【F I】

C 07 H 19/048

【手続補正書】

【提出日】平成29年7月14日(2017.7.14)

【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

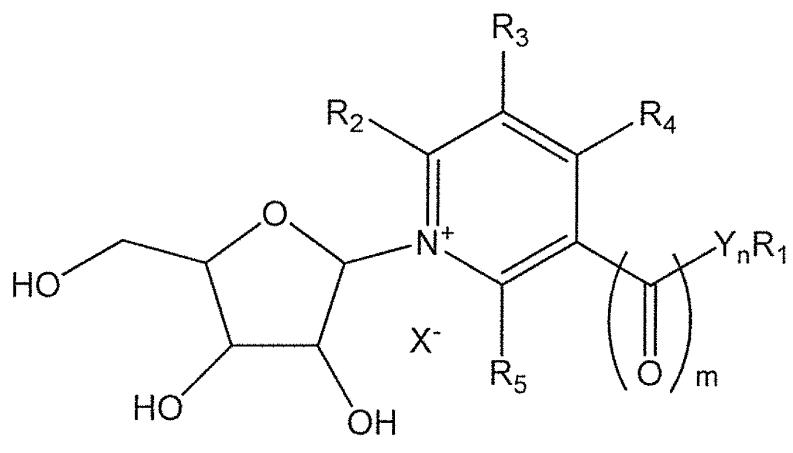
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)

【化1】



(I)

の化合物を調製する方法であって、式中、

nが0または1であり；

mが0または1であり；

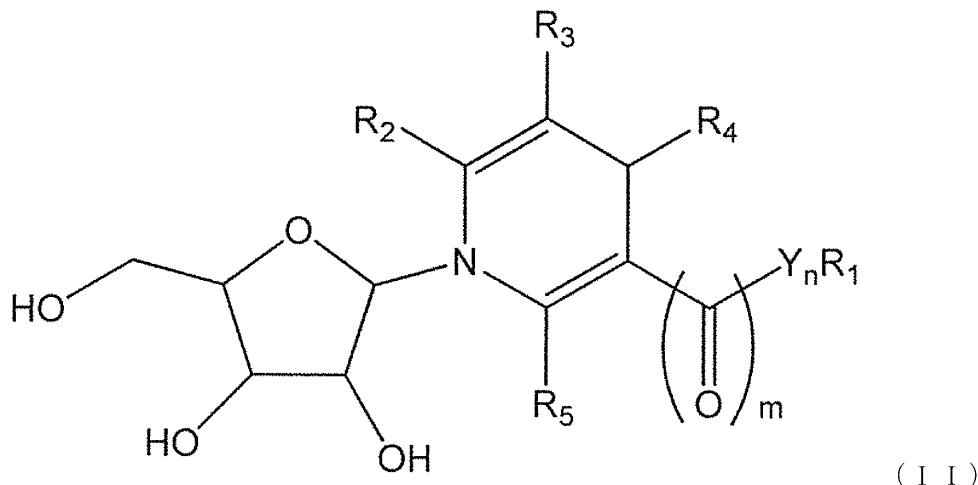
YがOまたはSであり；

R₁がH、置換または非置換アルキル、置換または非置換アルケニル、置換または非置換アルキニル、置換または非置換アリール、置換または非置換の第一級または第二級アミノ、および置換または非置換アジドから選択され；

R₂～R₅が、同じであっても異なっていてもよく、それぞれ独立してH、置換または非置換アルキル、置換または非置換アルケニル、置換または非置換アルキニル、および置換または非置換アリールから選択され；かつ

X⁻が、置換または非置換カルボン酸の陰イオン、ハロゲン化物、置換または非置換スルホン酸、置換または非置換リン酸、置換または非置換硫酸、置換または非置換炭酸、および置換または非置換カルバミン酸から選択される陰イオンであり；

前記方法は、水溶液および炭素含有触媒の存在下で、
式 (I I)
【化 2】



[式中、n、m、YおよびR₁～R₅は上で定義される通りである]
の化合物を、
式Z⁺X⁻

[式中、X⁻は上で定義される通りであり、かつZ⁺はN含有陽イオンである]
の化合物と

反応させて式(I)の化合物を形成させることを含み、
前記炭素含有触媒は活性炭であり、

任意選択で活性炭は金属の担体としてのものであってよく、前記金属は任意選択で遷移金属であってよい、
方法。

【請求項2】

Z⁺が、置換または非置換アンモニウム、置換または非置換ピリジニウム、置換または非置換ピロリジニウム、置換または非置換イミダゾリウムおよび置換または非置換トリアゾリウムから選択され、

任意選択で、Z⁺が、式N⁺H R^I R^I R^I R^Iの置換または非置換アンモニウムであってよく、式中、R^I、R^IおよびR^Iが、同じであっても異なっていてもよく、それぞれ独立してH、置換または非置換アルキル、置換または非置換アルケニル、置換または非置換アルキニル、および置換または非置換アリールから選択される、請求項1に記載の方法。

【請求項3】

式(I I)の化合物と式Z⁺X⁻の化合物が、それぞれ約1：5～約5：1、任意選択で約1：3～約3：1、さらに任意選択で約1：2～約2：1、さらに任意選択で約1：1のモル比で存在する、請求項1～2のいずれかに記載の方法。

【請求項4】

式(I I)の化合物と前記炭素含有触媒が、それぞれ約10：1～約1：10、任意選択で約5：1～約1：5、さらに任意選択で約4：1～約1：4、さらに任意選択で約1：1または1：2または1：3または1：4のモル比で存在する、請求項1～3のいずれかに記載の方法。

【請求項5】

前記反応が、約6～約8のpH範囲で、任意選択で約6.5～約7.5のpH範囲で実施される、請求項1～4のいずれかに記載の方法。

【請求項6】

X⁻が、置換または非置換モノカルボン酸の陰イオンおよび置換または非置換ジカルボ

ン酸の陰イオンから選択される置換または非置換カルボン酸の陰イオンであり、
任意選択で、 X^- が、置換モノカルボン酸の陰イオンであってもよく、さらに任意選択で置換プロパン酸の陰イオンまたは置換酢酸の陰イオンであってもよい、請求項1～5のいずれかに記載の方法。

【請求項7】

式 Z^+X^- の化合物が、塩化アンモニウム、酢酸アンモニウム、ギ酸アンモニウム、トリフルオロ酢酸アンモニウム、アスコルビン酸アンモニウム、アスパラギン酸アンモニウム、グルタミン酸アンモニウムおよび乳酸アンモニウムから選択され、任意選択で塩化アンモニウム、酢酸アンモニウム、ギ酸アンモニウムおよびトリフルオロ酢酸アンモニウムから選択されてもよい、請求項1～5のいずれか1項に記載の方法。

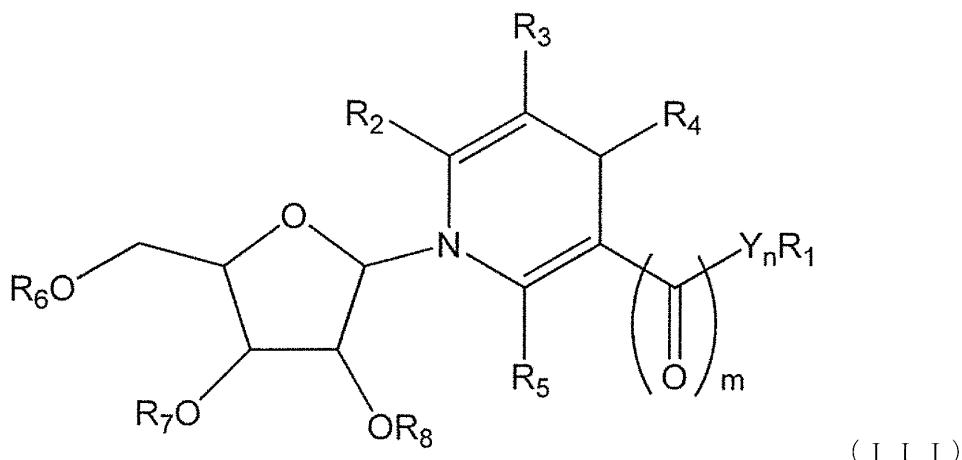
【請求項8】

式(I)の化合物において、nが0であり、mが1であり、 R_1 が NH_2 であり、 R_2 ～ R_5 がそれぞれHであり、かつ X^- が塩化物、酢酸、ギ酸およびトリフルオロ酢酸から選択される、請求項1～5のいずれか1項に記載の方法。

【請求項9】

式(III)

【化3】



[式中、n、m、Yおよび R_1 ～ R_5 は上で定義される通りであり、かつ R_6 、 R_7 および R_8 は、同じであっても異なっていてもよく、それぞれ独立してヒドロキシル保護基である]

の化合物を、

脱保護剤と

反応させて式(I)の化合物を形成させることによって、式(II)の化合物が調製される、請求項1～8のいずれかに記載の方法。

【請求項10】

R_6 、 R_7 および R_8 が、それぞれ独立してエステル型保護基、エーテル型保護基、またはシリル型保護基である、請求項9に記載の方法。

【請求項11】

R_6 、 R_7 および R_8 部分が、置換および非置換アセチル、ならびに置換および非置換ベンゾイルから選択され、

任意選択で、 R_6 、 R_7 および R_8 のうち少なくとも2つが、非置換アセチルまたは非置換ベンゾイルから選択されてもよく、

さらに任意選択で、 R_6 、 R_7 および R_8 が、それぞれ非置換アセチルまたは非置換ベンゾイルを含み、かつ前記脱保護剤が、塩基であり、任意選択で NH_3 、 Na_2CO_3 および $NaOH$ から選択される、

請求項9または10に記載の方法。

【請求項12】

前記脱保護剤が、酸または塩基である、請求項9～11のいずれか1項に記載の方法。

【請求項13】

前記反応が、プロトン性溶媒もしくは非プロトン性溶媒またはそれらの組合せの存在下で実施される、請求項9～12のいずれか1項に記載の方法。

【請求項14】

式(I II I)の化合物において、

nが0であり、mが1であり、R₁がNH₂であり、R₂～R₅がそれぞれHであり、かつR₆～R₈がそれぞれアセチルであるか、または

nが1であり、YがOであり、mが1であり、R₁がエチルであり、R₂～R₅がそれぞれHであり、かつR₆～R₈がそれぞれアセチルであるか、または

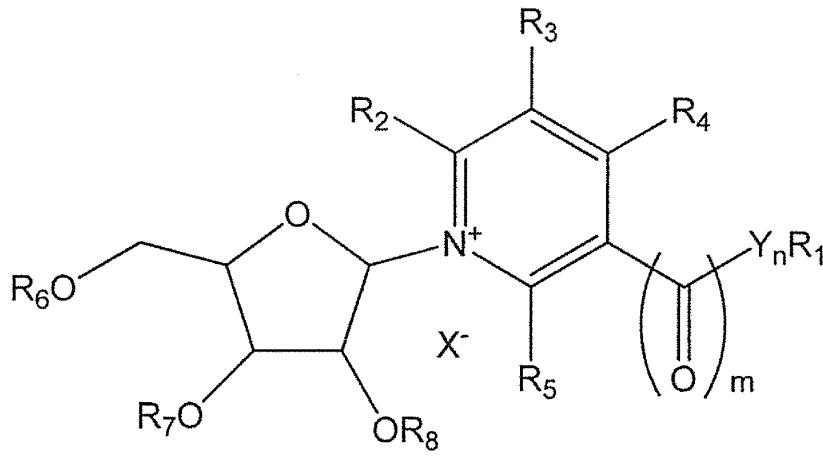
nが0であり、mが1であり、R₁がNH₂であり、R₂～R₅がそれぞれHであり、かつR₆～R₈がそれぞれベンゾイルである、

請求項9～13のいずれか1項に記載の方法。

【請求項15】

式(I V)

【化4】



(I V)

[式中、n、m、Y、R₁～R₈およびX⁻は上で定義される通りである]の化合物を、

還元剤、水溶液、および有機溶媒と

反応させて式(I II I)の化合物を形成させることによって、式(I II I)の化合物が調製される、請求項9～14のいずれか1項に記載の方法。

【請求項16】

R₆、R₇およびR₈のうち少なくとも2つが非置換アセチルを含む場合、前記有機溶媒が、ジクロロメタン、1,2-クロロエタン、酢酸n-ブチル、クロロホルムおよび酢酸エチル、またはそれらの組合せから選択され、さらに任意選択で酢酸エチルである、請求項15に記載の方法。

【請求項17】

R₂、R₃およびR₄のうち少なくとも2つが非置換ベンゾイルを含む場合、前記有機溶媒が、トリクロロエチレン、四塩化炭素、ジイソプロピルエーテル、トルエン、メチルtert-ブチルエーテル、ベンゼンおよびジエチルエーテル、またはそれらの組合せから選択され、さらに任意選択でジエチルエーテルである、請求項15に記載の方法。

【請求項18】

前記還元剤が、亜ジチオン酸ナトリウムまたは水素化ホウ素ナトリウムから選択される、請求項15～17のいずれか1項に記載の方法。

【請求項19】

式(I V)の化合物において、

nが0であり、mが1であり、R₁がNH₂であり、R₂～R₅がそれぞれHであり

、 $R_6 \sim R_8$ がそれぞれアセチルであり、かつ X^- が $-OTf$ であるか、または
 n が 1 であり、 Y が O であり、 m が 1 であり、 R_1 がエチルであり、 $R_2 \sim R_5$ がそ
れぞれ H であり、 $R_6 \sim R_8$ がそれぞれアセチルであり、かつ X^- が $-OTf$ であるか、
または
 n が 0 であり、 m が 1 であり、 R_1 が NH_2 であり、 $R_2 \sim R_5$ がそぞれ H であり
、かつ $R_6 \sim R_8$ がそれぞれベンゾイルであり、かつ X^- が $-OTf$ である、
請求項 15 ~ 18 のいずれか 1 項に記載の方法。