

【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19年8月23日(2007.8.23)

【公表番号】特表2007-518680(P2007-518680A)

【公表日】平成19年7月12日(2007.7.12)

【年通号数】公開・登録公報2007-026

【出願番号】特願2006-518643(P2006-518643)

【国際特許分類】

C 0 7 D 239/47 (2006.01)

C 0 7 D 239/34 (2006.01)

C 0 7 C 275/34 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 239/47 C S P Z

C 0 7 D 239/34

C 0 7 C 275/34

【手続補正書】

【提出日】平成19年6月11日(2007.6.11)

【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

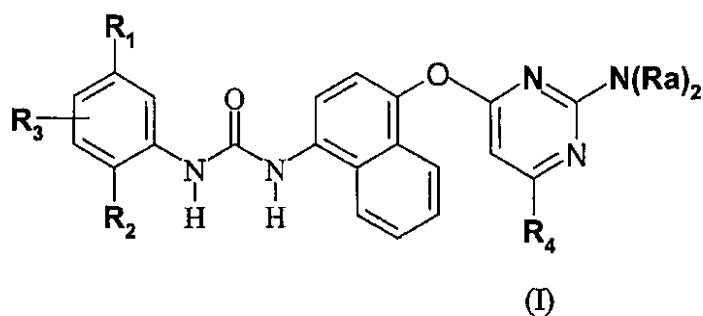
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)の化合物の製造方法であって、

【化1】



(式中、

R_1 は、分枝されている又は分枝されていない C_{1-10} アルキル又は C_{3-10} シクロアルキルであり、それぞれは任意に部分的又は完全にハロゲン化されていてもよく、

R_2 は、分枝されている又は分枝されていない C_{1-10} アルキル、分枝されている又は分枝されていない C_{1-10} アルコキシ、 C_{3-10} シクロアルキルであり、それぞれは任意に部分的又は完全にハロゲン化されていてもよく、且つ任意にアリールで置換されていてもよく、又は R_2 はアリールであり、

R_3 は、フェニル環の3-位又は4-位に結合しており、水素、 C_{1-10} アルキル、炭素環、複素環、複素アリール又は $R_4-S(O)_2-NH-$ であり、 R_4 は、 C_{1-5} アルキル又は炭素環から選択され、

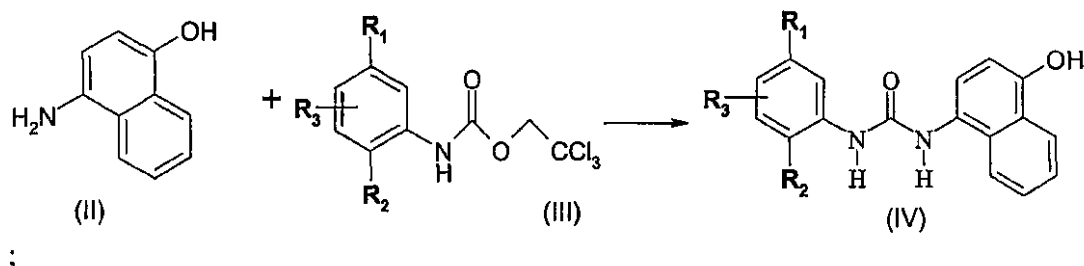
R_4 は、 C_{1-5} アルキル又は C_{1-5} アルコキシから選択され、

$N(Ra)_2$ に関して、 Ra は、水素、 C_{1-5} アルキル、アリール、アリール C_{1-3} アルキル、 C_{3-7} シクロアルキル、 C_{3-7} シクロアルキル C_{1-3} アルキル、 C_{1-5} アルコキシ C_{1-5} アルキル及び複

素環 C_{1-3} アルキルから独立して選択され、該複素環は、テトラヒドロフラン、ピロリジン及びモルホリニルから選択され、各 R_a は、1つ又は2つの C_{1-5} アルキル、 C_{1-5} アルコキシ、又は C_{1-5} アルキル二置換アミノによって任意に置換されていてもよい。）

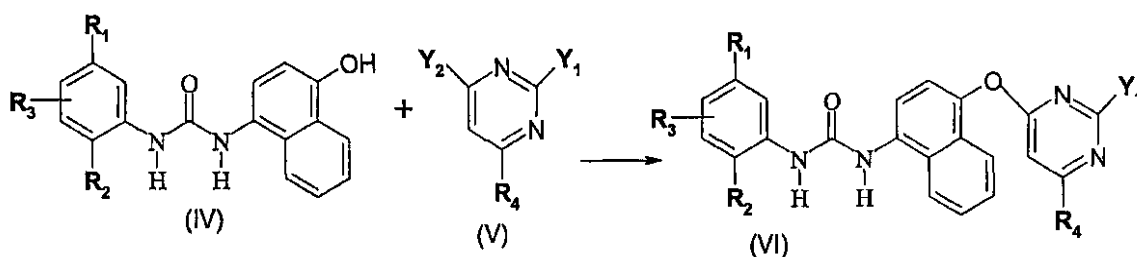
a) 非プロトン性溶媒及び非プロトン性塩基の存在下、0 ~ 100 の温度で1~24時間、アリアルアミン(II)を、式(III)のカルバメートと反応させて、式(IV)の中間化合物を製造し、

【化2】



b) 極性溶媒及び非プロトン性塩基の存在下、0 ~ 100 の温度で1~24時間、式(IV)の中間化合物を、式(V)の化合物と反応させて、式(VI)の中間化合物を製造し、

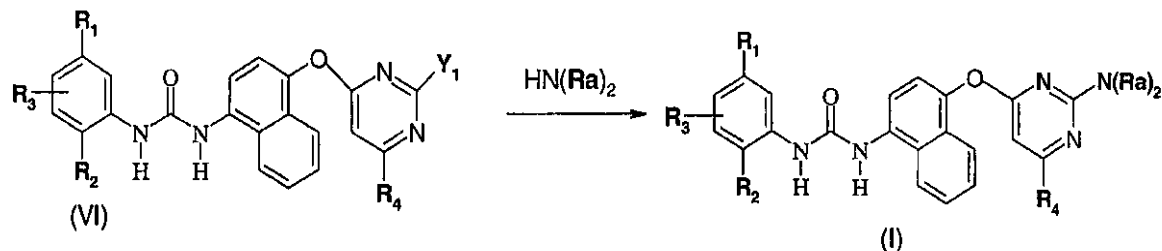
【化3】



(式(V)中、 Y_1 は、Cl、Br、I及びFから選択されるハロゲンであり、 Y_2 は、Cl及びFから選択されるハロゲンである。)

c) 極性溶媒及び非プロトン性塩基の存在下、0 ~ 100 の温度で1~24時間、式(VI)の化合物を、 $HN(Ra)_2$ 化合物(式中、 Ra は上記の通り)と反応させて、式(I)の化合物を製造し、その後生成化合物を単離することを含む、方法。

【化4】



【請求項2】

請求項1記載の方法であって、

工程a)において、

非プロトン性溶媒が、NMP、DMSO、THF、EtOAc及びジオキサンから選択され、

非プロトン性塩基が、N-メチルピロリジノン、N-メチルピロリジン、トリエチルアミン

、DMAPから選択され、

時間が16時間であり、及び

温度が45 であり、

工程b)において、

Y_1 がClであり、 Y_2 がClであり、
極性溶媒が C_{1-5} アルコールであり、
非プロトン性塩基がカルボネートであり、
時間が24時間であり、及び
温度が45 であり、
工程c)において、

極性非プロトン性溶媒が、KFを含んだジオキサン、トルエン、TGME、トリエチレングリコールから選択され、
時間が18時間であり、及び
温度が60 である、方法。

【請求項3】

請求項2記載の方法であって、
工程a)において、

非プロトン性溶媒が、NMP、DMSO、THF、EtOAc、及びジオキサンから選択され、

非プロトン性塩基が、N-メチルピロリジノン、N-メチルピロリジン、トリエチルアミン及びDMAPから選択され、トリエチルアミンは1.35当量の量であり、DMAPは0.2当量の量であり、

工程b)において、

Y_1 がClであり、 Y_2 がClであり、
極性溶媒がエタノールであり、
カルボネートが Na_2CO_3 であり、
工程c)において、

極性非プロトン性溶媒が、KFを含んだTGMEである、方法。

【請求項4】

請求項1記載の方法であって、

R_1 が、 $-CF_3$ 、 $-CH(CH_3)(CF_3)$ 、 $-CH(CF_3)_2$ 、 $-OCF_3$ 、又は $-CF_2CF_3$ であり、

R_2 が、 $-O-C_{1-5}$ アルキルであり、

R_3 が、水素又は $R_4-S(O)_2-NH-$ であり、 R_4 は、 C_{1-5} アルキル又は炭素環から選択され、

R_4 が、 C_{1-4} アルキル又は C_{1-4} アルコキシから選択される、方法。

【請求項5】

請求項4記載の方法であって、

R_2 が、 $-O-C_{1-3}$ アルキルであり、

$N(Ra)_2$ に関して、 Ra が、水素、 C_{1-5} アルキル、フェニル C_{1-3} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{3-6} シクロアルキル C_{1-3} アルキル、 C_{1-3} アルコキシ C_{1-3} アルキル及び複素環 C_{1-3} アルキルから独立して選択され、該複素環は、テトラヒドロフラン、ピロリジニル及びモルホリニルから選択され、各 Ra は、1つ又は2つの C_{1-3} アルキル、 C_{1-3} アルコキシ、又は C_{1-2} アルキル二置換アミノで任意に置換されていてもよく、

R_4 が、 C_{1-3} アルキル又は C_{1-3} アルコキシから選択される、方法。

【請求項6】

請求項5記載の方法であって、

R_1 が、 $-CF_3$ 、 $-CH(CH_3)(CF_3)$ 、 $-CH(CF_3)_2$ 又は $-CF_2CF_3$ であり、

R_2 が、 $-O-C_{1-2}$ アルキルであり、

R_4 が、 C_{1-2} アルキル又は C_{1-2} アルコキシから選択される、方法。

【請求項7】

請求項6記載の方法であって、

R_1 が、 $-CF_3$ であり、

R_2 が、 $-O-CH_3$ であり、

R_4 が、メチル又はメトキシである、方法。

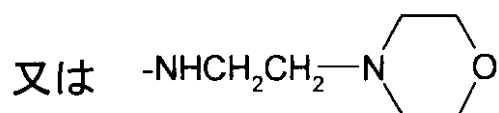
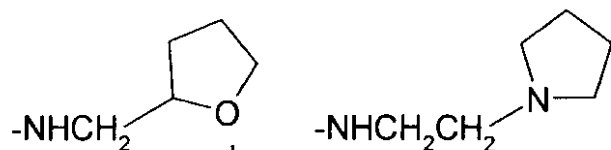
【請求項8】

請求項7記載の方法であって、

R_4 が、メチルであり、

$N(Ra)_2$ が、 NH_2 、 $NH(CH_3)$ 、 $-NHCH_2CH_2N(CH_3)_2$ 、 $-NHCH_2CH_2-O-CH_3$ 、 $-NH-CH_2-N(CH_3)_2$ 、

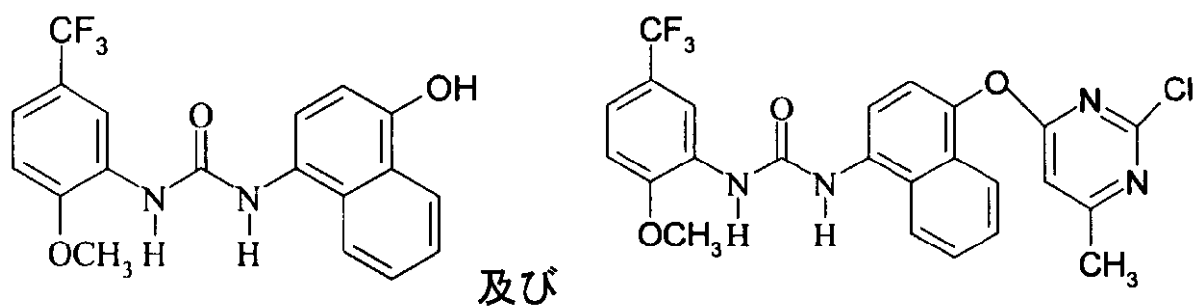
【化 5】



である、方法。

【請求項 9】

【化 6】



及び

から選択される、化合物。

【請求項 10】

工程(c)において、

極性非プロトン性溶媒がKFを含んだTGMEである、請求項3記載の方法。