

【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】令和3年1月14日(2021.1.14)

【公開番号】特開2020-169174(P2020-169174A)
【公開日】令和2年10月15日(2020.10.15)
【年通号数】公開・登録公報2020-042
【出願番号】特願2020-88633(P2020-88633)
【国際特許分類】

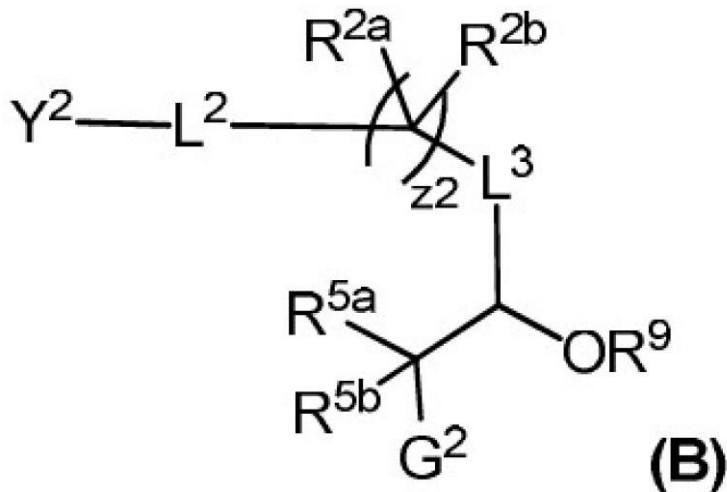
C 0 7 H 17/08 (2006.01)
A 6 1 K 31/7052 (2006.01)
A 6 1 P 11/00 (2006.01)
A 6 1 P 29/00 (2006.01)
A 6 1 P 31/00 (2006.01)
A 6 1 P 31/04 (2006.01)
A 6 1 P 33/00 (2006.01)
C 0 7 F 7/18 (2006.01)

【F I】

C 0 7 H 17/08 C S P B
A 6 1 K 31/7052
A 6 1 P 11/00
A 6 1 P 29/00
A 6 1 P 31/00
A 6 1 P 31/04
A 6 1 P 33/00
C 0 7 F 7/18 N

【手続補正書】
【提出日】令和2年11月16日(2020.11.16)
【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

【化1】



式中、

Y^2 は $-Z^4H$ 、 $-CH_2NO_2$ 、脱離基 (LG)、 $-C(=O)R^{Z^3}$ 、 $-C(=O)OR^{Z^3}$ 、 $-C(=O)LG$ 、 $-C(=O)-CH=P(R^{P^1})(R^{P^2})(R^{P^3})$ 、
 または $-C(=O)-CH_2-P(O)(OR^{P^2})(OR^{P^3})$ であり、

Z^4 は $-O-$ 、 $-S-$ 、または $-NR^{Z^2}-$ であり、

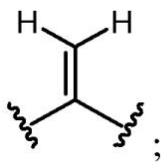
R^{P^1} 、 R^{P^2} 、および R^{P^3} はそれぞれ独立して任意置換アルキル、任意置換アルケニル、任意置換アルキニル、任意置換カルボシクリル (carbocyclyl)、任意置換ヘテロシクリル、任意置換アリール、または任意置換ヘテロアリールであり、

L^2 は、結合または $-CH_2-$ であり、

z^2 は、0、1、または 2 であり、

R^{2a} 、および R^{2b} のそれぞれは独立して水素、ハロゲン、カルボニル、任意置換アルキル、任意置換アルケニル、任意置換アルキニル、任意置換カルボシクリル、任意置換ヘテロシクリル (heterocyclyl)、任意置換アリール、任意置換ヘテロアリールであるか、
 または R^{2a} および R^{2b} が一緒になって

【化2】



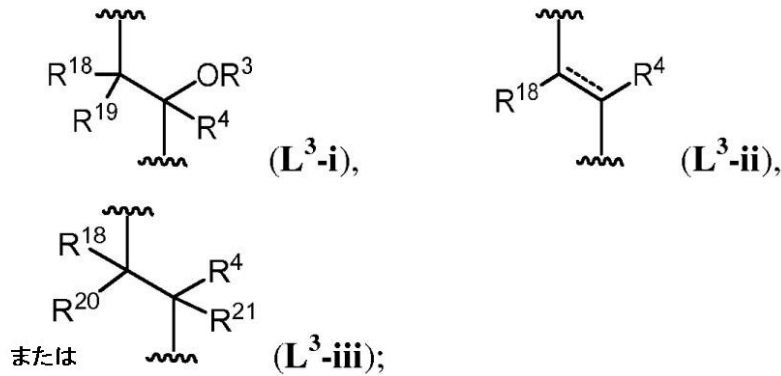
を形成し得、

R^{Z^2} のそれぞれは独立して水素、任意置換アルキル、任意置換アルケニル、任意置換アルキニル、任意置換カルボシクリル、任意置換ヘテロシクリル (heterocyclyl)、任意置換アリール、任意置換ヘテロアリール、ヒドロキシル、置換ヒドロキシル、アミノ、置換アミノ、 $-C(=O)R^{Z^8}$ 、 $-C(=O)OR^{Z^8}$ 、 $-C(=O)N(R^{Z^8})_2$ 、もしくは窒素保護基であるか、または 2 つの R^{Z^2} 基が連結されて任意置換ヘテロシクリル (heterocyclyl) もしくは任意置換ヘテロアリール環を形成し、

R^{Z^3} は水素、任意置換アルキル、任意置換アルケニル、任意置換アルキニル、任意置換カルボシクリル、任意置換ヘテロシクリル (heterocyclyl)、任意置換アリール、または任意置換ヘテロアリールであり、

L^3 は式

【化3】



の基であり、

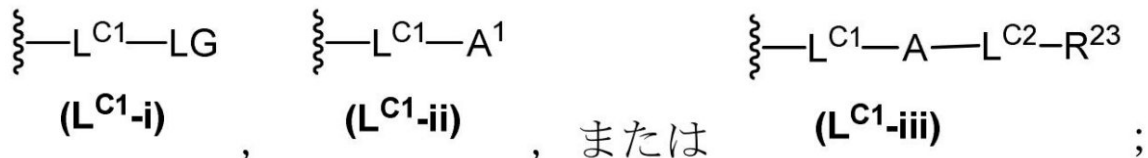
【化4】

=====

は単または二重結合を表し、

R^3 は水素、任意置換アルキル、任意置換アルケニル、任意置換アルキニル、任意置換カルボシクリル、任意置換ヘテロシクリル、任意置換アリール、任意置換ヘテロアリール、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^{\text{Z}8}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^{\text{Z}8}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{R}^{\text{Z}8})_2$ 、酸素保護基、または式

【化5】



の基であり、

R^4 は水素、任意置換アルキル、任意置換アルケニル、任意置換アルキニル、任意置換カルボシクリル、任意置換ヘテロシクリル、任意置換アリール、または任意置換ヘテロアリールであり；

R^{18} および R^{19} のそれぞれは独立して水素、任意置換アルキル、任意置換アルケニル、任意置換アルキニル、任意置換カルボシクリル、任意置換ヘテロシクリル、任意置換アリール、または任意置換ヘテロアリールであり；

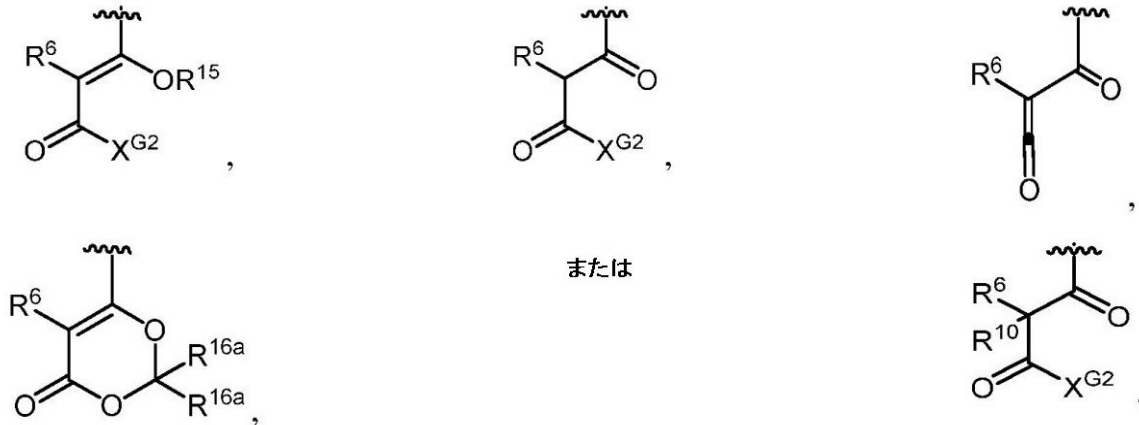
R^{20} および R^{21} のそれぞれは独立して水素、任意置換アルキル、任意置換アルケニル、任意置換アルキニル、任意置換カルボシクリル、任意置換ヘテロシクリル、任意置換アリール、任意置換ヘテロアリール、ヒドロキシル、置換ヒドロキシル、チオール、置換チオール、アミノ、置換アミノ、ハロゲン、カルボニルであるか、または R^{20} および R^{21} が連結されて任意置換シクロプロピルもしくはオキシラニル環を形成し、

R^{5a} および R^{5b} のそれぞれは独立して水素、ハロゲン、シリル、任意置換アルキル、任意置換カルボシクリル、または任意置換ヘテロシクリルであり；

R^9 は水素、任意置換アルキル、任意置換アルケニル、任意置換アルキニル、任意置換カルボシクリル、任意置換ヘテロシクリル、任意置換アリール、任意置換ヘテロアリール、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^{\text{Z}8}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^{\text{Z}8}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{R}^{\text{Z}8})_2$ 、酸素保護基、または炭水化物であり、

G^2 は式

【化6】



の基であり、

R^6 は、水素、任意置換アルキル、任意置換アルケニル、任意置換アルキニル、任意置換カルボシクリル、任意置換ヘテロシクリル、任意置換アリール、任意置換アラルキル、任意置換ヘテロアリール、任意置換ヘテロアラルキル、ヒドロキシル、置換ヒドロキシル、チオール、置換チオール、アミノ、置換アミノ、カルボニル、シリル、またはハロゲンであり；

R^{10} は、水素、任意置換アルキル、任意置換アルケニル、任意置換アルキニル、任意置換カルボシクリル、任意置換ヘテロシクリル、任意置換アリール、任意置換ヘテロアリール、ヒドロキシル、置換ヒドロキシル、チオール、置換チオール、アミノ、置換アミノ、カルボニル、シリル、またはハロゲンであり；

X^{G2} のそれぞれは $-OR^{15}$ 、 $-SR^{15}$ 、または $-N(R^{15})_2$ であり；

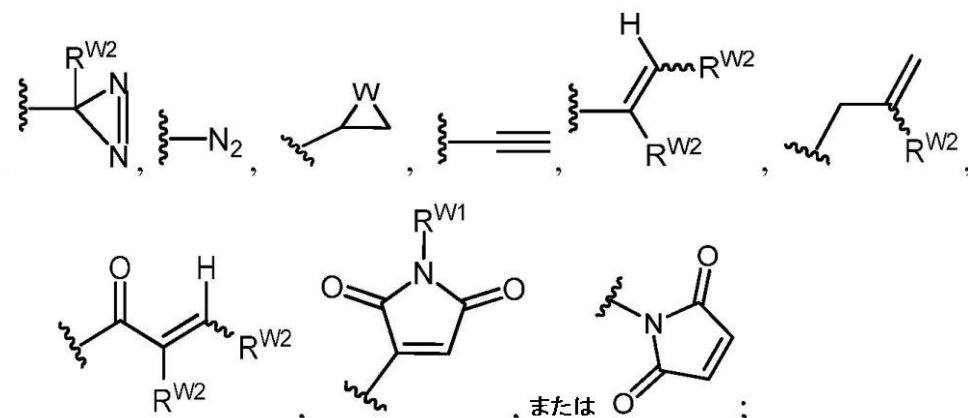
R^{15} のそれぞれは独立してシリル、任意置換アルキル、任意置換アルケニル、任意置換アルキニル、任意置換カルボシクリル、任意置換ヘテロシクリル、任意置換アリール、または任意置換ヘテロアリールであるか、または2つの R^{15} 基が一緒になって任意置換ヘテロアリールもしくはヘテロ環式環を形成し得；および

R^{16a} のそれぞれは独立して水素、任意置換アルキル、任意置換アルケニル、任意置換アルキニル、任意置換カルボシクリル、任意置換ヘテロシクリル、任意置換アリール、または任意置換ヘテロアリールであり、

L^{C1} および L^{C2} のそれぞれは独立して結合であるか、または任意置換アルキレン、任意置換アルケニレン、任意置換アルキニレン、任意置換ヘテロアルキレン、任意置換ヘテロアルケニレン、任意置換ヘテロアルキニレン、またはその組み合わせであり、

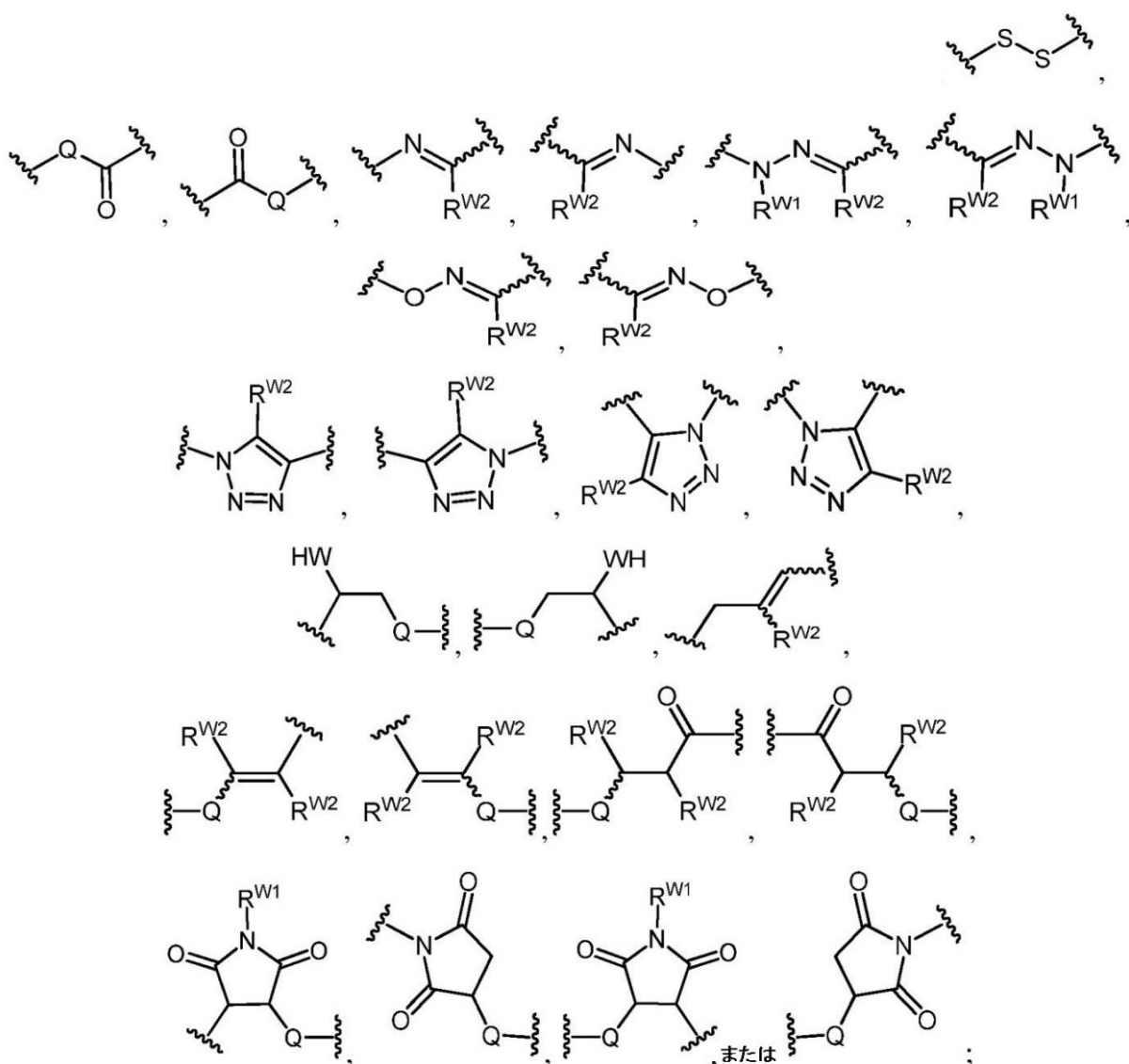
A^1 のそれぞれは独立して脱離基 (LG)、 $-SH$ 、 $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH-NH_2$ 、 $-N_3$ 、 $-O-NH_2$ 、 $-C(=O)R^{X1}$ 、

【化7】



であり、

Aは -NH-、-NH-NH-、-NH-O-、-O-NH-、-S-、-O-、
【化8】



任意置換カルボシクリル、任意置換ヘテロシクリル、任意置換アリール、または任意置換ヘテロアリールであり；

Qは -NH-、-NH-NH-、-O-NH-、-NH-O-、-S-、または -O-
であり；

WはO、S、または NR^{W1} であり；

R^{W1} は水素、置換もしくは無置換アルキル、置換もしくは無置換アルケニル、置換もしくは無置換アルキニル、置換もしくは無置換カルボシクリル、置換もしくは無置換ヘテロシクリル、置換もしくは無置換アリール、置換もしくは無置換ヘテロアリール、または窒素保護基であり；

R^{W2} は水素、任意置換アルキル、任意置換アルケニル、任意置換アルキニル、任意置換カルボシクリル、任意置換ヘテロシクリル、任意置換アリール、任意置換ヘテロアリールであるか、または2つの R^{W2} 基が連結されて任意置換環式部分を形成し；

R^{X1} は水素、ハロゲン、または -OR^{X2} であり、 R^{X2} は水素、任意置換アルキル、任意置換アルキル、任意置換アルケニル、任意置換アルキニル、任意置換カルボシクリル、任意置換ヘテロシクリル、任意置換アリール、任意置換ヘテロアリール、または酸素保護基であり；

R^{23} は任意置換アルキル、任意置換アルケニル、任意置換アルキニル、任意置換カル

ボシクリル、任意置換ヘテロシクリル、任意置換アリール、または任意置換ヘテロアリールであり；および

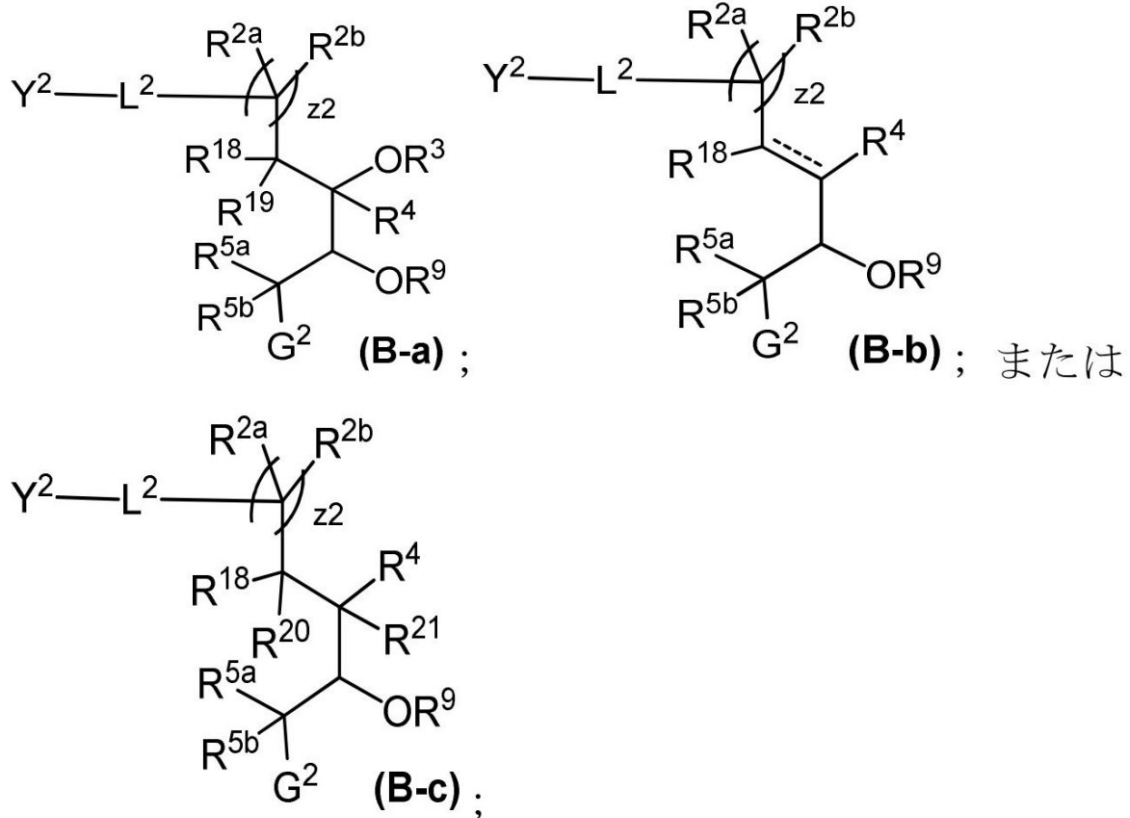
R^{2-8} のそれぞれは独立して水素、任意置換アルキル、任意置換アルケニル、任意置換アルキニル、任意置換カルボシクリル、任意置換ヘテロシクリル (heterocyclyl)、任意置換アリール、または任意置換ヘテロアリールであるか、あるいは2つの R^{2-8} 基が連結されて任意置換ヘテロシクリル (heterocyclyl) または任意置換ヘテロアリール環を形成する、

で表される化合物、またはその塩。

【請求項2】

化合物が式

【化9】

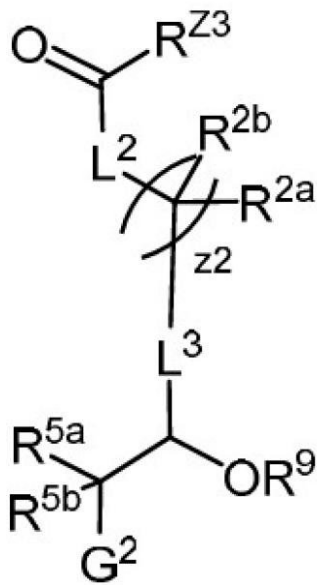


またはその塩である、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

化合物が式

【化 1 0】

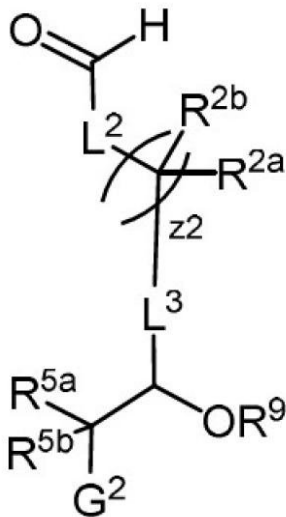


またはその塩である、請求項 1 または 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

化合物が式

【化 1 1】

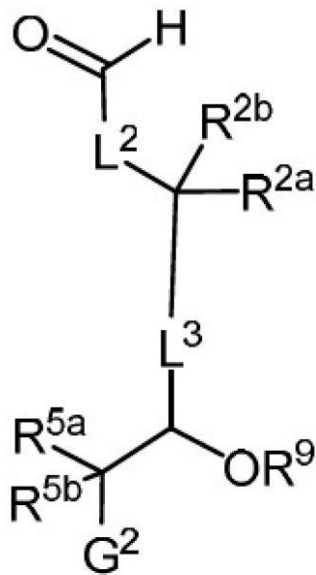


またはその塩である、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 5】

化合物が式

【化 1 2】



またはその塩である、請求項 1 ~ 4 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 6】

Y^2 が、脱離基 (LG)、 $-C(=O)R^{Z3}$ 、 $-C(=O)OR^{Z3}$ 、 $-C(=O)LG$ 、 $-C(=O)-CH=P(R^{P1})(R^{P2})(R^{P3})$ 、または $-C(=O)-CH_2-P(O)(OR^{P2})(OR^{P3})$ である、請求項 1 または 2 に記載の化合物またはその塩。

【請求項 7】

Y^2 が、 $-C(=O)-CH=P(R^{P1})(R^{P2})(R^{P3})$ 、または $-C(=O)-CH_2-P(O)(OR^{P2})(OR^{P3})$ である、請求項 1、2 または 6 のいずれか一項に記載の化合物またはその塩。

【請求項 8】

Y^2 が、 $-C(=O)R^{Z3}$ である、請求項 1、2 または 6 のいずれか一項に記載の化合物またはその塩。

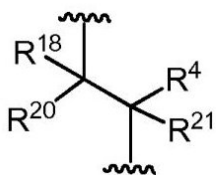
【請求項 9】

Y^2 が、 $-C(=O)R^{Z3}$ であり、 R^{Z3} が水素である、請求項 1、2、6 または 8 のいずれか一項に記載の化合物またはその塩。

【請求項 10】

L^3 が式

【化 1 3】

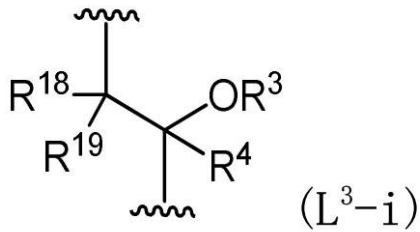


の基であり、 R^{21} が水素である、請求項 1、または 3 ~ 9 のいずれか一項に記載の化合物、またはその塩。

【請求項 11】

L^3 が式

【化 1 4】

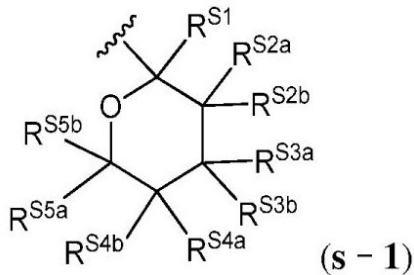


の基である、請求項 1、または 3 ~ 9 のいずれか一項に記載の化合物、またはその塩。

【請求項 1 2】

R⁹ が式

【化 1 5】



の基であり、

R^{S 1}、R^{S 2 a}、R^{S 2 b}、R^{S 3 a}、R^{S 3 b}、R^{S 4 a}、R^{S 4 b}、R^{S 5 a}、および R^{S 5 b} のそれぞれが独立して水素、任意置換アルキル、-OR^{S 0}、-N(R^{S N})₂ であるか、または R^{S 2 a} または R^{S 2 b} が R^{S 3 a} または R^{S 3 b} と一緒になって任意置換縮合ヘテロ環式環を形成し得；

R^{S 0} のそれぞれが独立して水素、任意置換アルキル、任意置換アルケニル、任意置換ヘテロシクリル、または酸素保護基であり；および

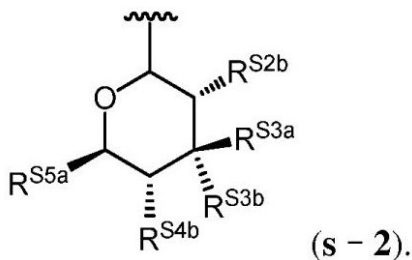
R^{S N} のそれぞれが独立して水素、任意置換アルキル、または窒素保護基であるか、あるいは任意に 2 つの R^{S N} が介在原子と一緒にヘテロ環式環を形成する、

請求項 1 ~ 1 1 のいずれか一項に記載の化合物、またはその塩。

【請求項 1 3】

R⁹ が式

【化 1 6】

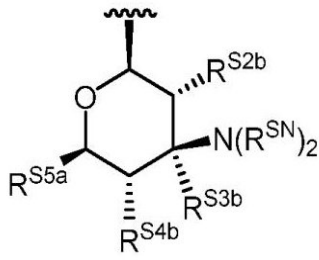


の基である、請求項 1 ~ 1 2 のいずれか一項に記載の化合物、またはその塩。

【請求項 1 4】

R⁹ が式

【化 1 7】



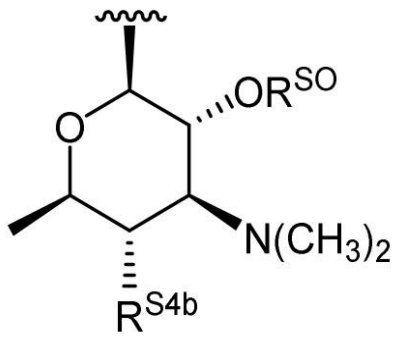
(s-2a)

の基である、請求項 1 ~ 1 3 のいずれか一項に記載の化合物、またはその塩。

【請求項 1 5】

R^9 が式

【化 1 8】



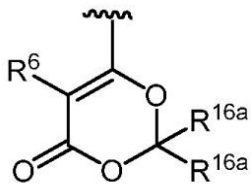
(s-2a-i)

の基である、請求項 1 ~ 1 4 のいずれか一項に記載の化合物、またはその塩。

【請求項 1 6】

G 2 が式

【化 1 9】



の基である、請求項 1 ~ 1 5 のいずれか一項に記載の化合物、またはその塩。

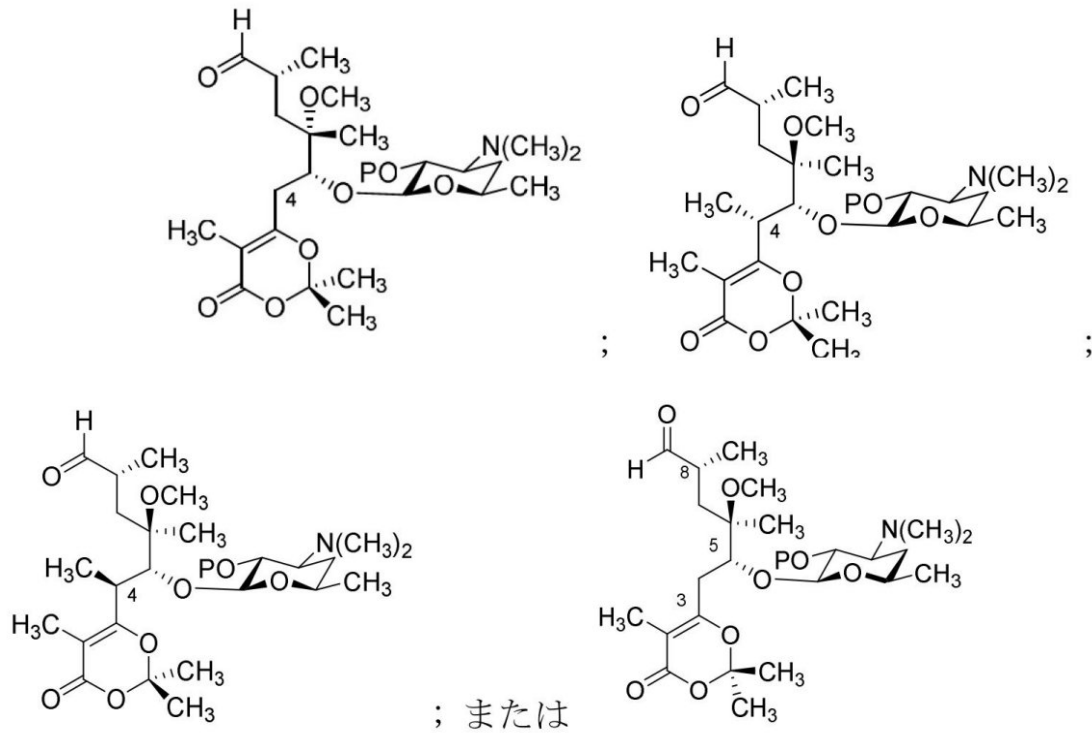
【請求項 1 7】

R^{16a} のそれぞれが独立して、任意置換アルキルである、請求項 1 ~ 1 6 のいずれか一項に記載の化合物、またはその塩。

【請求項 1 8】

化合物が、式

【化 2 0】



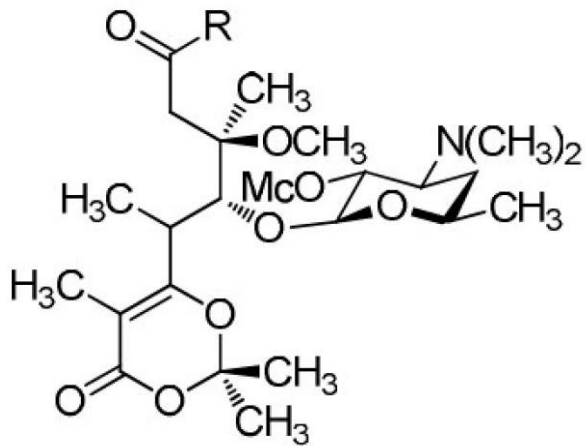
またはその塩であって、

式中、Pは酸素保護基である、請求項1に記載の化合物。

【請求項19】

化合物が、式

【化 2 1】



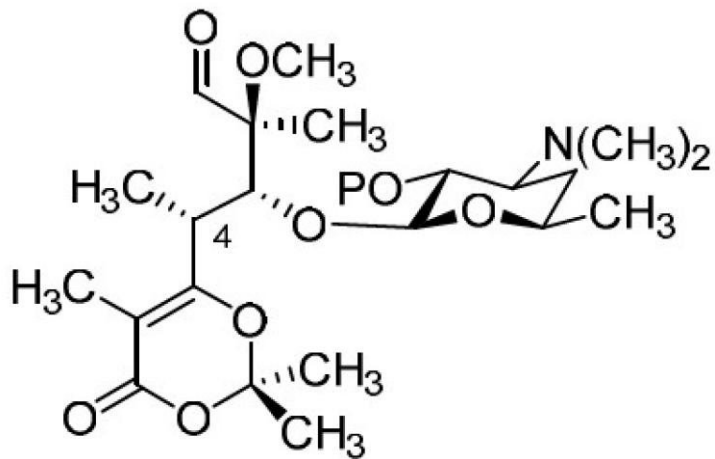
またはその塩であって、

式中、Rが任意置換アルキル、任意置換アルケニル、任意置換アルキニル、任意置換カルボシクリル、任意置換ヘテロシクリル、任意置換アリール、もしくは任意置換ヘテロアリールである、請求項1に記載の化合物。

【請求項20】

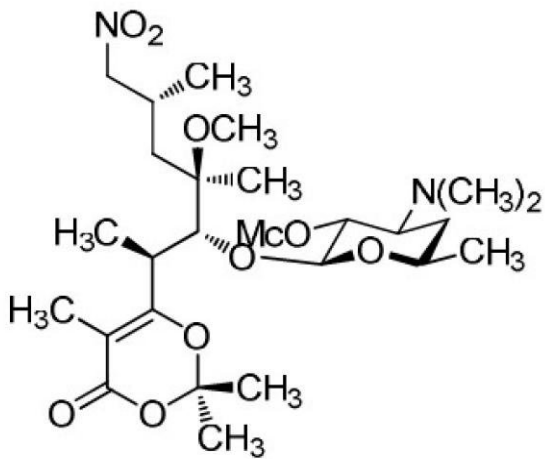
化合物が、式

【化 2 2】



またはその塩であって、
 式中、Pは酸素保護基である、請求項1に記載の化合物。

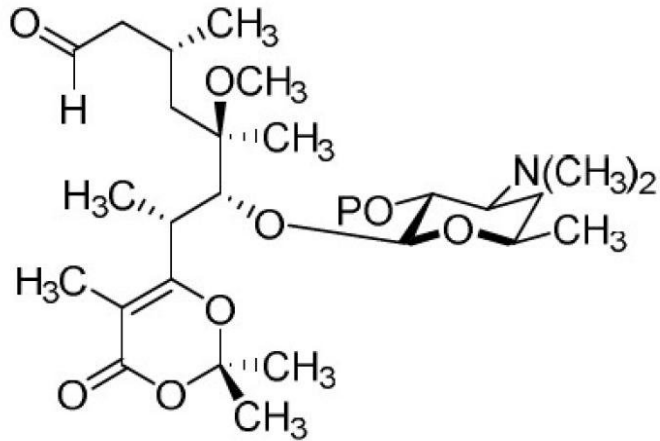
【請求項21】
 化合物が、式
 【化23】



またはその塩である、請求項1に記載の化合物。

【請求項22】
 化合物が、式

【化 2 4】



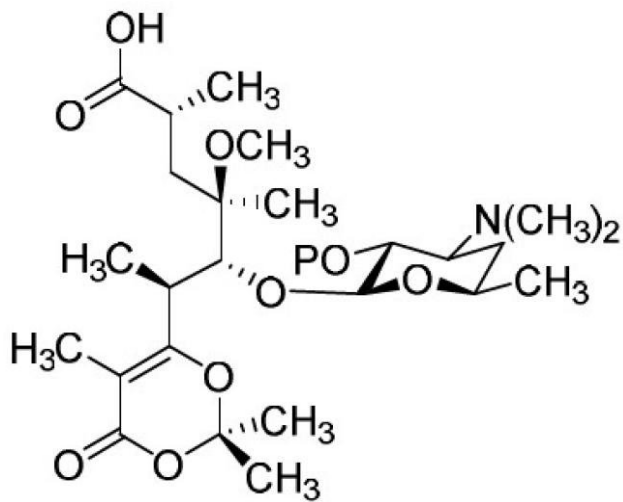
またはその塩であって、

式中、Pは酸素保護基である、請求項1に記載の化合物。

【請求項 2 3】

化合物が、式

【化 2 5】



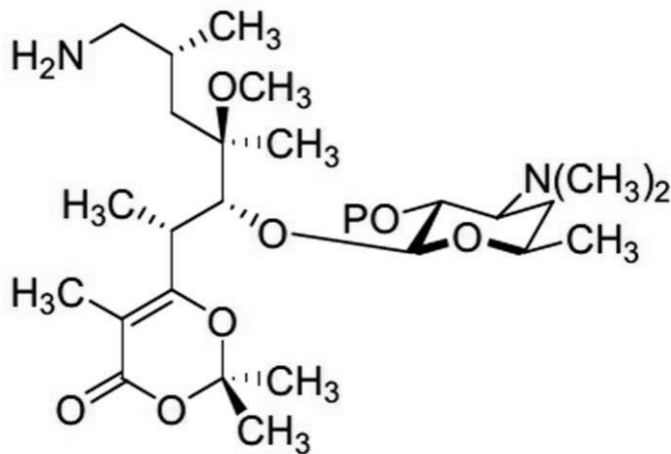
またはその塩であって、

式中、Pは酸素保護基である、請求項1に記載の化合物。

【請求項 2 4】

化合物が、式

【化 2 6】



またはその塩であって、

式中、Pは酸素保護基である、請求項1に記載の化合物。

【請求項 2 5】

Pが、メチル、メトキシメチル(MOM)、メチルチオメチル(MTM)、t-ブチルチオメチル、(フェニルジメチルシリル)メトキシメチル(SMOM)、ベンジルオキシメチル(BOM)、p-メトキシベンジルオキシメチル(PMBM)、(4-メトキシフェノキシ)メチル(p-AOM)、グアイアコールメチル(GUM)、t-ブトキシメチル、4-ペンテニルオキシメチル(POM)、シロキシメチル、2-メトキシエトキシメチル(MEM)、2,2,2-トリクロロエトキシメチル、ビス(2-クロロエトキシ)メチル、2-(トリメチルシリル)エトキシメチル(SEMOR)、テトラヒドロピラニル(THP)、3-プロモテトラヒドロピラニル、テトラヒドロチオピラニル、1-メトキシシクロヘキシル、4-メトキシテトラヒドロピラニル(MTHP)、4-メトキシテトラヒドロチオピラニル、4-メトキシテトラヒドロチオピラニルS、S-ジオキシド、1-[(2-クロロ-4-メチル)フェニル]-4-メトキシピペリジン-4-イル(CTMP)、1,4-ジオキサソ-2-イル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロチオフラニル、2,3,3a,4,5,6,7,7a-オクタヒドロ-7,8,8-トリメチル-4,7-メタノベンゾフラン-2-イル、1-エトキシエチル、1-(2-クロロエトキシ)エチル、1-メチル-1-メトキシエチル、1-メチル-1-ベンジルオキシエチル、1-メチル-1-ベンジルオキシ-2-フルオロエチル、2,2,2-トリクロロエチル、2-トリメチルシリルエチル、2-(フェニルセレニル)エチル、t-ブチル、アリル、p-クロロフェニル、p-メトキシフェニル、2,4-ジニトロフェニル、ベンジル(Bn)、p-メトキシベンジル、3,4-ジメトキシベンジル、o-ニトロベンジル、p-ニトロベンジル、p-ハロベンジル、2,6-ジクロロベンジル、p-シアノベンジル、p-フェニルベンジル、2-ピコリル、4-ピコリル、3-メチル-2-ピコリルN-オキシド、ジフェニルメチル、p,p'-ジニトロベンズヒドリル、5-ジベンゾスベリル(dibenzosuberyl)、トリフェニルメチル、-ナフチルジフェニルメチル、p-メトキシフェニルジフェニルメチル、ジ(p-メトキシフェニル)フェニルメチル、トリ(p-メトキシフェニル)メチル、4-(4'プロモフェナシルオキシフェニル)ジフェニルメチル、4,4',4''-トリス(4,5-ジクロロフタルイミドフェニル)メチル、4,4',4''-トリス(レプリノイルオキシフェニル)メチル、4,4',4''-トリス(ベンゾイルオキシフェニル)メチル、3-(イミダゾール-1-イル)ビス(4',4''-ジメトキシフェニル)メチル、1,1-ビス(4-メトキシフェニル)-1'-ピレニルメチル、9-アントリル、9-(9-フェニル)キサントニル、9-(9-フェニル-10-オキソ)アントリル、1,3-ベンゾジチオラン-2-イル、ベンゾイソチアゾリルS,S-ジオキシド、トリメチルシリル(TMS)、トリエチルシリル

(T E S)、トリイソプロピルシリル (T I P S)、ジメチルイソプロピルシリル (I P D M S)、ジエチルイソプロピルシリル (D E I P S)、ジメチルテキシルシリル、t - ブチルジメチルシリル (T B D M S)、t - ブチルジフェニルシリル (T B D P S)、トリベンジルシリル、トリ - p - キシリルシリル、トリフェニルシリル、ジフェニルメチルシリル (D P M S)、t - ブチルメトキシフェニルシリル (T B M P S)、ホルマート、ベンゾイルホルマート、アセタート、クロロアセタート、ジクロロアセタート、トリクロロアセタート、トリフルオロアセタート、メトキシアセタート、トリフェニルメトキシアセタート、フェノキシアセタート、p - クロロフェノキシアセタート、3 - フェニルプロピオナート、4 - オキソペンタノアート (レプリナート)、4 , 4 - (エチレンジチオ) ペンタノアート (レプリノイルジチオアセタール)、ピバロエート (pivaloate)、アダマントエート (adamantate)、クロトナート、4 - メトキシクロトナート、ベンゾアート、p - フェニルベンゾアート、2 , 4 , 6 - トリメチルベンゾアート (メシトアート)、メチルカーボネート、9 - フルオレニルメチルカーボネート (F m o c)、エチルカーボネート、2 , 2 , 2 - トリクロロエチルカーボネート (T r o c)、2 - (トリメチルシリル) エチルカーボネート (T M S E C)、2 - (フェニルスルホニル) エチルカーボネート (P s e c)、2 - (トリフェニルホスホニオ) エチルカーボネート (P e o c)、イソブチルカーボネート、ビニルカーボネート、アリルカーボネート、t - ブチルカーボネート (B O C)、p - ニトロフェニルカーボネート、ベンジルカーボネート、p - メトキシベンジルカーボネート、3 , 4 - ジメトキシベンジルカーボネート、o - ニトロベンジルカーボネート、p - ニトロベンジルカーボネート、S - ベンジルチオカーボネート、4 - エトキシ - 1 - ナフトチル (naphthyl) カーボネート、メチルジチオカーボネート、2 - ヨードベンゾアート、4 - アジドブチレート、4 - ニトロ - 4 - メチルペンタノアート、o - (ジプロモメチル) ベンゾアート、2 - ホルミルベンゼンスルホナート、2 - (メチルチオメトキシ) エチル、4 - (メチルチオメトキシ) ブチラート、2 - (メチルチオメトキシメチル) ベンゾアート、2 , 6 - ジクロロ - 4 - メチルフェノキシアセタート、2 , 6 - ジクロロ - 4 - (1 , 1 , 3 , 3 - テトラメチルブチル) フェノキシアセタート、2 , 4 - ビス (1 , 1 - ジメチルプロピル) フェノキシアセタート、クロロジフェニルアセタート、イソブチラート、モノスクシノアート (monosuccinoate)、(E) - 2 - メチル - 2 - プテノアート、o - (メトキシアシル) ベンゾアート、 - ナフトアート、ニトラート、アルキル , , ' , ' - テトラメチルホスホロジアミダート、アルキル N - フェニルカルバメート、ボラート、ジメチルホスフィノチオイル、アルキル 2 , 4 - ジニトロフェニルスルフェナート、スルファート、メタンスルホナート (メシレート)、ベンジルスルホナート、またはトシラート (T s) である、請求項 18、20 または 22 ~ 24 のいずれか一項に記載の化合物、またはその塩。

【請求項 26】

P が、メチルカーボネートである、請求項 18、20 および 22 ~ 25 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその塩。