

【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18年11月9日(2006.11.9)

【公表番号】特表2006-502178(P2006-502178A)

【公表日】平成18年1月19日(2006.1.19)

【年通号数】公開・登録公報2006-003

【出願番号】特願2004-537146(P2004-537146)

【国際特許分類】

C 0 7 D 257/04 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 257/04 C S P E

C 0 7 M 7:00

【誤訳訂正書】

【提出日】平成18年9月21日(2006.9.21)

【誤訳訂正1】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 1 9

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0 0 1 9】

水素または水素ドナーでの還元的アミノ化に適した触媒は、たとえば、ニッケル、たとえばラネーニッケル、および貴金属またはそれらの誘導体、たとえば酸化物、たとえばパラジウム、白金または酸化白金(所望により、これを支持体、たとえば炭素または炭酸カルシウムに適用してもよく、たとえば炭素担持プラチナ)である。水素または水素ドナーでの水素化は、好ましくは、1～約100気圧の圧力で、そして、約-80～約200の温度、特に室温から約100の温度で行われ得る。

【誤訳訂正2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 4 6

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0 0 4 6】

たとえば、有機金属試薬からテトラゾール環を保護するためのトリフェニルメチル基が使用される。トリフェニルメチル基は、後で、酸性条件下ではずされる。トリフェニルメチル基の不利な点は、その分子量が大きいことと考えられている。2-フェニル-2-プロピルテトラゾール保護基が、任意のさらなる変換の前のメタレーション(metallation)を可能にするために使用される。この保護基の除去は、腐食性および毒性の試薬、たとえば三フッ化ホウ素エーテラート、または脱保護の工程を触媒する遷移金属を必要とし、これらは不利な点とみなされる。

【誤訳訂正3】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 6 8

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0 0 6 8】

R_2 が保護基を表し、そして R_1 が水素または保護基である場合、たとえば、2当量の式(IId)の化合物、たとえば対応するそのハライド、および塩基、たとえばエチル-ジイソプロピル-アミンまたはトリ-n-プロピルアミンの両方を、適当な溶媒、たとえ

ばトルエンに溶かした対応する式 (I I c) の化合物に添加する。驚くべきことに、ラセミ化は観察されない。

【誤訳訂正 4】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0074

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0074】

たとえば、ベンジルエステルは、とりわけ、適当な水素化触媒の存在下での水素化により、対応する酸に変換され得る。適当な触媒には、たとえば、ニッケル、たとえばラネーニッケル、および貴金属またはそれらの誘導体、たとえば酸化物、たとえばパラジウムまたは酸化白金 (所望により、これを支持体、たとえば炭素または炭酸カルシウムに適用してもよい。) が含まれる。水素化は、好ましくは、1 ~ 約 100 atm の圧力で、そして約 - 80 ~ 約 200 の 温度 にて、特に室温から約 100 にて行われ得る。

【誤訳訂正 5】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0106

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0106】

b) (S) - 3 - メチル - { 2 - ペンタノイル - [2' - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) - ビフェニル - 4 - イル - メチル] - アミノ } - 酪酸 ベンジルエステルの製造
先の工程からのトルエン (約 80 g、48 ~ 50 mmol) 中の (S) - 3 - メチル - 2 - { [2' - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) - ビフェニル - 4 - イル - メチル] - アミノ } - 酪酸 ベンジルエステルの溶液を、トルエン (85 ml) で希釈する。無水条件下で、N - エチル - ジイソプロピルアミン (24.0 ml、140 mmol) および塩化バレロイル (17.3 ml、140 mmol) を内部温度 20 にてゆっくり添加する。反応混合物を約 30 分間攪拌し、そして変換の終了後、20 でのメタノール (31 ml) の添加によりクエンチする。透明溶液を 20 にて約 30 分間攪拌し、水 (78 ml) を添加し、そして得られる二相系を、2.0 M 塩酸 (約 10 ml、20 mmol) の添加により pH 2 に調節する。有機相を分離し、水 (78 ml) で抽出し、そして蒸発により元の容積の約 50 % まで真空中 50 にて濃縮する (水およびメタノールを共沸除去する)。トルエン (約 94 g) 中の得られる濃縮物に、結晶化を開始させるために 40 にて種晶を入れ、そしてこの温度にて約 1 時間攪拌する。この懸濁液を、6 ~ 10 時間以内に 0 まで徐々に冷却する。固体を濾過により分離し、冷トルエン (60 ml) で洗浄し、そして真空中 50 にて乾燥すると、(S) - 3 - メチル - { 2 - ペンタノイル - [2' - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) - ビフェニル - 4 - イル - メチル] - アミノ } - 酪酸 ベンジルエステルを得る。

融点 : 115 - 116 .

鏡像体過剰率 (HPLC による) : ee > 99.8 % .