

【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26年10月16日(2014.10.16)

【公表番号】特表2014-520901(P2014-520901A)

【公表日】平成26年8月25日(2014.8.25)

【年通号数】公開・登録公報2014-045

【出願番号】特願2014-522149(P2014-522149)

【国際特許分類】

C 07 D 233/58 (2006.01)

【F I】

C 07 D 233/58

【手続補正書】

【提出日】平成26年9月1日(2014.9.1)

【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

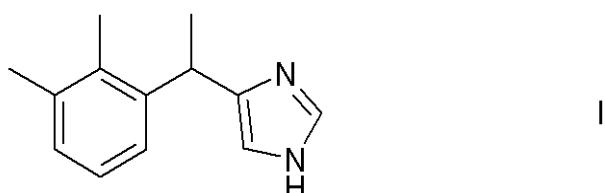
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式Iの化合物

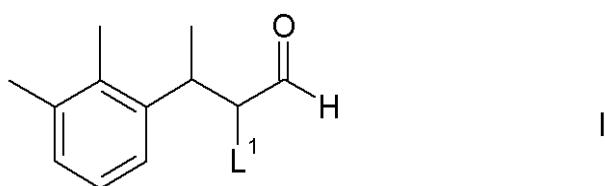


の調製プロセスであって、

(a) ホルムアミジン源；または

(b) ホルムアミド

の存在下での、式IIの化合物



[式中、L<sup>1</sup>は脱離基を表す]

の反応を含むプロセス。

【請求項2】

(a) 前記プロセスが、ホルムアミジン、ホルムアミジン酢酸塩、ホルムアミジンハロゲン化水素塩、ホルムアミジンスルフィン酸、または塩化アンモニウムとギ酸との混合物の存在下で行われ；および/または

(b) L<sup>2</sup>がハロ基、スルホネート基、またはオキシ-アシリル基を表す、

請求項 1 に記載のプロセス。

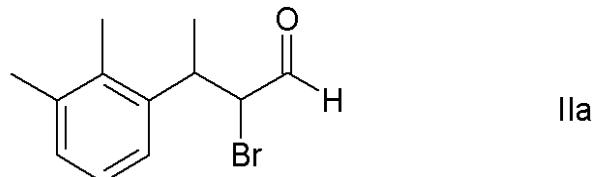
**【請求項 3】**

- (i) 前記プロセスがホルムアミジン酢酸塩の存在下で行われ；および／または
- (ii) L<sup>1</sup> がプロモを表す、

請求項 1 または請求項 2 に記載のプロセス。

**【請求項 4】**

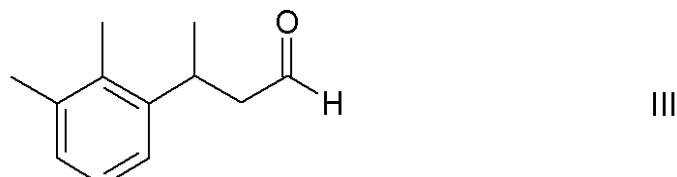
式 IIa の化合物：



。

**【請求項 5】**

L<sup>1</sup> がプロモを表す（請求項 4 に記載のように）式 II の化合物の調製プロセスであつて、式 III の化合物



の臭素化を含むプロセス。

**【請求項 6】**

前記臭素化が 5, 5 - ジプロモバルビツール酸の存在下で行われる、請求項 5 に記載のプロセス。

**【請求項 7】**

前記反応が、式 IIa の化合物



[ 式中、

R<sup>a</sup> および R<sup>b</sup> は、どちらも独立して、ハロ、-CN および C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルコキシ（ここで、後者の基は、1 つ以上のフルオロ原子で置換されていてもよい）から選択される 1 つ以上の置換基で置換されていてもよい C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル基を表すか、または

R<sup>a</sup> および R<sup>b</sup> は、全体として、それらがどちらも結合している窒素原子と共に、場合によっては O、S および NR<sup>c</sup> から選択される 1 つまたは 2 つの追加ヘテロ原子含有基を含有し、かつハロ、-CN、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキルおよび C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルコキシ（ここで、後者 2 つの基は 1 つ以上のフルオロ原子で置換されていてもよい）から選択される 1 つ以上の置換基で置換されていてもよい、5 員または 6 員ヘテロシクロアルキル基を形成し；かつ

R<sup>c</sup> は、H または C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル基を表し、ここで、後者の基は、ハロ、-CN および C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルコキシ（ここで、後者の基は、1 つ以上のフルオロ原子で置換されていてもよい）から選択される 1 つ以上の置換基で置換されていてもよい]

の存在下で行われる、請求項 5 に記載のプロセス。

**【請求項 8】**

(a) 式 I I I a の化合物がモルホリンであり；および / または  
 (b) 前記反応が臭素の存在下で行われる、

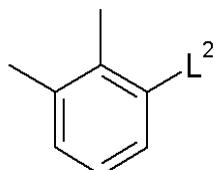
請求項 7 に記載のプロセス。

**【請求項 9】**

請求項 5 に定義する式 I I I の化合物。

**【請求項 10】**

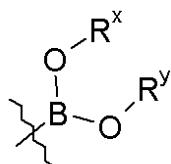
請求項 5 に定義する式 I I I の化合物の調製プロセスであって、  
 式 I V の化合物



IV

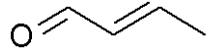
[式中、L<sup>2</sup> は、

- (i) ハロ (最も好ましくはブロモ) ;
- (ii) 式 - N<sub>2</sub> X の基 (式中、X は適切な負荷電対イオン (例えば B F<sup>4-</sup>) を表す) ; または
- (iii) 以下の式の構造フラグメント



(式中、R<sup>x</sup> および R<sup>y</sup> は、それぞれ独立して、H または C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキルを表すか、あるいは、R<sup>x</sup> および R<sup>y</sup> は、全体として、1つ以上のメチルで置換されていてもよい C<sub>2</sub> - C<sub>3</sub> アルキレンを形成する)  
 を表す]

の式 V の化合物 (クロトンアルデヒド)

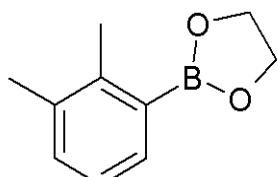


V

との反応を含むプロセス。

**【請求項 11】**

式 I V b の化合物

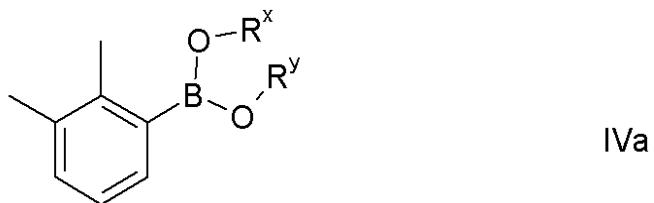


IVb

の反応を含む、請求項 10 に記載のプロセス。

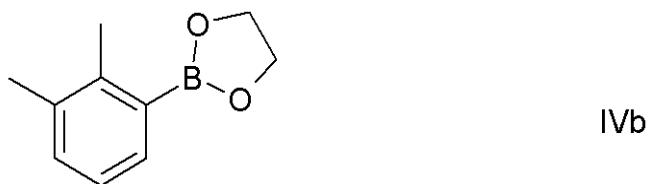
**【請求項 12】**

式 I V a



[式中、 $R^x$  および  $R^y$  は、それぞれ独立して、 $C_{1\sim 6}$  アルキルを表すか、あるいは  $R^x$  および  $R^y$  が、全体として、 $C_{2\sim 3}$  アルキレンを形成する]

または式 I V b



の化合物。

**【請求項 1 3】**

請求項 1 から 3 のいずれか一項に記載するように式 I の化合物を調製し、次に、そうして形成された式 I の化合物（またはその塩）を、製剤の一部を形成する成分と結びつけるプロセスを含むことを特徴とする、請求項 1 に定義する式 I の化合物またはその塩を含む製剤の調製プロセス。