

【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8月10日(2006.8.10)

【公表番号】特表2006-503077(P2006-503077A)

【公表日】平成18年1月26日(2006.1.26)

【年通号数】公開・登録公報2006-004

【出願番号】特願2004-540938(P2004-540938)

【国際特許分類】

C 07 D 495/04 (2006.01)

C 07 D 333/36 (2006.01)

【F I】

C 07 D 495/04 103

C 07 D 333/36 CSP

【手続補正書】

【提出日】平成18年6月22日(2006.6.22)

【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

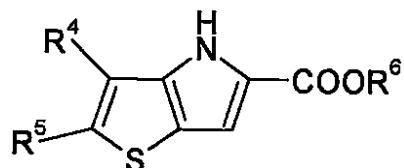
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)の化合物

【化1】

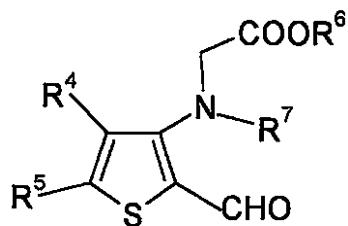


(I)

[式中、R⁴およびR⁵は、独立して、ハロから選択され；R⁶は水素または保護基である]の製造方法であって、

式(II)の化合物

【化2】



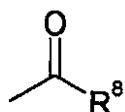
(II)

[式中、R⁴、R⁵およびR⁶は式(I)に関して定めたものであり、R⁷は窒素保護基である]を環化し、基R⁷を除去し、次いで必要であれば保護基R⁶を除去することを含む方法。

【請求項2】

R^7 が補助式(i)の基

【化3】



(i)

(式中、 R^8 は炭素原子1~6個の直鎖アルキル基である)である、請求項1に記載の方法。

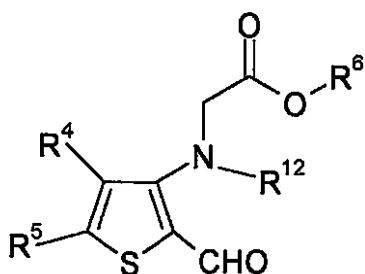
【請求項3】

請求項1に記載の式(II)の化合物。

【請求項4】

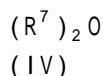
請求項3に記載の化合物の製造方法であって、式(III)の化合物

【化4】



(III)

[式中、 R^4 および R^5 は式(I)に関して定めたものであり、 R^{12} は指向性の窒素保護基である]と式(IV)の化合物



(式中、 R^7 は前記に定めたものである)を酸性条件下で反応させることを含む方法。

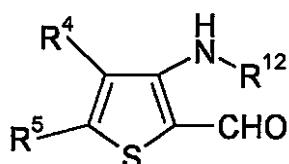
【請求項5】

請求項4に記載の式(III)の化合物。

【請求項6】

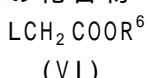
請求項5に記載の化合物の製造方法であって、式(V)の化合物

【化5】



(V)

[式中、 R^4 および R^5 は前記の請求項1に定めたものであり、 R^{12} は式(III)に関して定めたものである]と式(VI)の化合物



(式中、Lは脱離基である)を反応させることを含む方法。

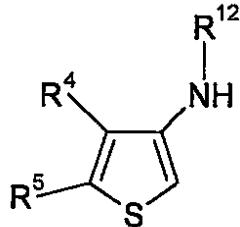
【請求項7】

請求項 6 に記載の式(V)の化合物。

【請求項 8】

請求項 7 に記載の化合物の製造方法であつて、式(VII)の化合物

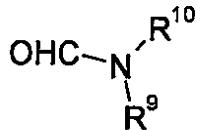
【化 6】



(VII)

[式中、R⁴およびR⁵は請求項1に定めたものであり、R¹²は式(III)に関して定めたものである]をリチウム化剤であるN-ブチルリチウムなどと反応させ、次いでホルミル化剤である式(VIII)の化合物

【化 7】



(VIII)

(式中、R⁹およびR¹⁰はアルキル基、特に炭素原子1~4個の低級アルキル基であるメチルなどである)などと反応させることを含む方法。

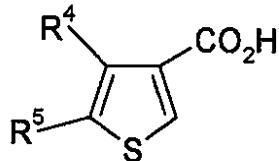
【請求項 9】

請求項8に記載の式(VII)の化合物。

【請求項 10】

請求項9に記載の化合物の製造方法であつて、式(IX)の化合物

【化 8】



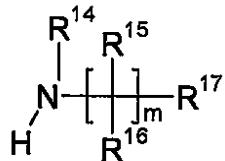
(IX)

[式中、R⁴およびR⁵は式(I)に関して前記に定めたものである]を、式R¹²OHのアルコール(式中、R¹²は請求項4に定めたものである)の存在下でクルチウス転位反応させることを含む方法。

【請求項 11】

R⁶が水素である式(I)の化合物を製造するための請求項1に記載の方法において、得られた式(I)の化合物をさらに、式(XIII)のアミン

【化9】



(XIID)

[式中、R¹⁴は、水素またはC₁₋₈アルキルから選択され；

mは、0~4の整数であり；

R¹⁵は、それぞれ同一でも異なってもよく、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、アミノ、カルボキシ、カルバモイル、メルカプト、スルファモイル、ウレイド、C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₁₋₆アルコキシ、C₁₋₆アルカノイル、C₁₋₆アルカノイルオキシ、N-(C₁₋₆アルキル)アミノ、N,N-(C₁₋₆アルキル)₂アミノ、C₁₋₆アルカノイルアミノ、N-(C₁₋₆アルキル)カルバモイル、N,N-(C₁₋₄アルキル)₂カルバモイル、C₁₋₆アルキルS(0)_a (aは0~2である)、C₁₋₆アルコキシカルボニル、C₁₋₆アルコキシカルボニルアミノ、N-(C₁₋₆アルキル)スルファモイル、N,N-(C₁₋₆アルキル)₂スルファモイル、C₁₋₆アルキルスルホニルアミノ、C₁₋₆アルキルスルホニル-N-(C₁₋₆アルキル)アミノ、C₃₋₈シクロアルキル、C₃₋₈シクロアルキルC₁₋₆アルキル、アリール、アリールC₁₋₆アルキル、複素環式基、および(複素環式基)C₁₋₆アルキルから選択され；R¹は炭素においてPから選択される1個以上の基で置換されていてもよく、複素環式基が-NH-部分を含む場合、その窒素はRから選択される基で置換されていてもよく；

R¹⁶は、それぞれ同一でも異なってもよく、水素またはC₁₋₆アルキルから選択され；

R¹⁷は、水素、ハロ、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、アミノ、カルボキシ、カルバモイル、メルカプト、スルファモイル、ウレイド、C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₁₋₆アルコキシ、C₁₋₆アルカノイル、C₁₋₆アルカノイルオキシ、N-(C₁₋₆アルキル)アミノ、N,N-(C₁₋₆アルキル)₂アミノ、C₁₋₆アルカノイルアミノ、N-(C₁₋₆アルキル)カルバモイル、N,N-(C₁₋₄アルキル)₂カルバモイル、N-(C₁₋₆アルキル)-N-(C₁₋₆アルコキシ)カルバモイル、C₁₋₆アルキルS(0)_a (aは0~2である)、C₁₋₆アルコキシカルボニル、C₁₋₆アルコキシカルボニルアミノ、N-(C₁₋₆アルキル)スルファモイル、N,N-(C₁₋₆アルキル)₂スルファモイル、スルファモイルアミノ、N-(C₁₋₆アルキル)スルファモイルアミノ、N,N-(C₁₋₆アルキル)₂スルファモイルアミノ、C₁₋₆アルキルスルホニルアミノカルボニル、C₁₋₆アルキルスルホニル-N-(C₁₋₆アルキル)アミノおよび基-E-F-G-Hから選択され；

ここでEおよびGは、独立して、直接結合、-O-、-S-、-SO₂-、-OC(O)-、-C(O)O-、-C(O)-、-NR^a-、-NR^aC(O)-、-C(O)NR^a-、-SO₂NR^a-、-NR^aSO₂-、-NR^aC(O)NR^b-、-OC(O)NR^a-、-NR^aC(O)O-、-NR^aSO₂NR^b-、-SO₂NR^aC(O)-および-C(O)NR^aSO₂-から選択され；ここでR^aおよびR^bは独立して、水素、または基Vで置換されていてもよいC₁₋₆アルキルから選択され；

Fは、1個以上のQで置換されていてもよいC₁₋₆アルキレン、または直接結合であり；

Hは、アリール、C₃₋₈シクロアルキルおよび複素環式基から選択され；Hは炭素においてSから選択される1個以上の基で置換されていてもよく、複素環式基が-NH-部分を含む場合、その窒素はTから選択される基で置換されていてもよく；

P、SおよびQは、独立して、ハロ、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、アミノ、カルボキシ、カルバモイル、メルカプト、スルファモイル、ウレイド、C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₁₋₆アルコキシ、C₁₋₆アルカノイル、C₁₋₆アルカノイルオキシ、N-(C₁₋₆アルキル)アミノ、N,N-(C₁₋₆アルキル)₂アミノ、C₁₋₆アルカノイルアミノ、C₁₋₆アルカノイルアミノ、N-(C₁₋₆アルキル)カルバモイル、N,N-(C₁₋₆アルキル)カルバモイル

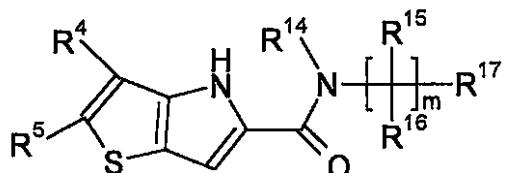
キル)₂カルバモイル、N-(C₁₋₆アルキル)-N-(C₁₋₆アルコキシ)カルバモイル、C₁₋₆アルキルS(0)_a(aは0~2である)、C₁₋₆アルコキシカルボニル、C₁₋₆アルコキシカルボニルアミノ、N-(C₁₋₆アルキル)スルファモイル、N,N-(C₁₋₆アルキル)₂スルファモイル、C₁₋₆アルキルスルホニルアミノ、C₁₋₆アルキルスルホニル-N-(C₁₋₆アルキル)アミノ、C₃₋₈シクロアルキル、アリールおよび複素環式基から選択され；P、SおよびQは、独立して、炭素においてVから選択される1個以上の基で置換されていてもよく、複素環式基が-NH-部分を含む場合、その窒素はUから選択される基で置換されていてもよく；

Vは、ハロ、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチル、アミノ、カルボキシ、カルバモイル、メルカブト、スルファモイル、メチル、エチル、メトキシ、エトキシ、アセチル、アセトキシ、メチルアミノ、エチルアミノ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、N-メチル-N-エチルアミノ、アセチルアミノ、N-メチルカルバモイル、N-エチルカルバモイル、N,N-ジメチルカルバモイル、N,N-ジエチルカルバモイル、N-メチル-N-エチルカルバモイル、メチルチオ、エチルチオ、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、メシリル、エチルスルホニル、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、N-メチルスルファモイル、N-エチルスルファモイル、N,N-ジメチルスルファモイル、N,N-ジエチルスルファモイル、N-メチル-N-エチルスルファモイル、モルホリノ、モルホリノカルボニル、N-ベンジルカルバモイルおよび4-ヒドロキシペリジノカルボニルから選択され；

R、TおよびUは、独立して、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルカノイル、C₁₋₄アルキルスルホニル、C₁₋₄アルコキシカルボニル、カルバモイル、N-(C₁₋₄アルキル)カルバモイル、N,N-(C₁₋₄アルキル)カルバモイル、フェニル、ベンジル、ベンジルオキシカルボニル、ベンゾイルおよびフェニルスルホニルから選択され、R、TおよびUは、独立して、炭素においてVから選択される1個以上の基で置換されていてもよい】

と反応させて、式(XIV)の化合物

【化10】



(XIV)

(式中、R⁴、R⁵、R¹⁵、R¹⁶、R¹⁷およびmは前記に定めたものである)またはその医薬的に許容できる塩もしくはそのインビポ加水分解性エステルを製造することを含む方法。