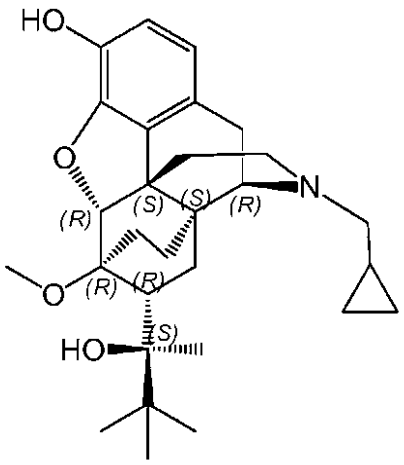
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】平成30年6月14日(2018.6.14)

【公表番号】特表2017-514846(P2017-514846A)
【公表日】平成29年6月8日(2017.6.8)
【年通号数】公開・登録公報2017-021
【出願番号】特願2016-565669(P2016-565669)
【国際特許分類】
Ｃ０７Ｄ　489/12　　(2006.01)
Ｃ０７Ｄ　489/08　　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　31/485　　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　25/04　　(2006.01)
【ＦＩ】
Ｃ０７Ｄ　489/12
Ｃ０７Ｄ　489/08
Ａ６１Ｋ　31/485
Ａ６１Ｐ　25/04

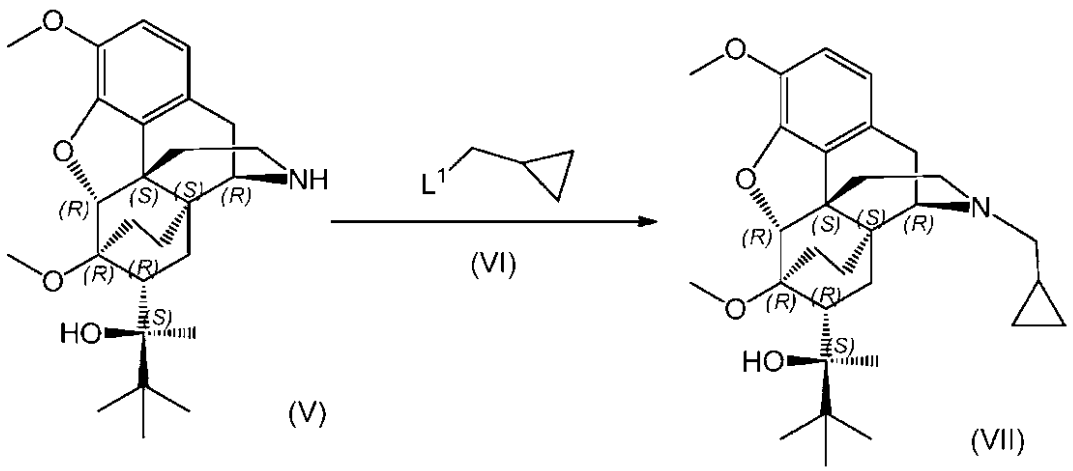
【手続補正書】
【提出日】平成30年4月27日(2018.4.27)
【手続補正１】
【補正対象書類名】特許請求の範囲
【補正対象項目名】全文
【補正方法】変更
【補正の内容】
【特許請求の範囲】
【請求項１】
式（Ｉ）の化合物
【化１】



(I)

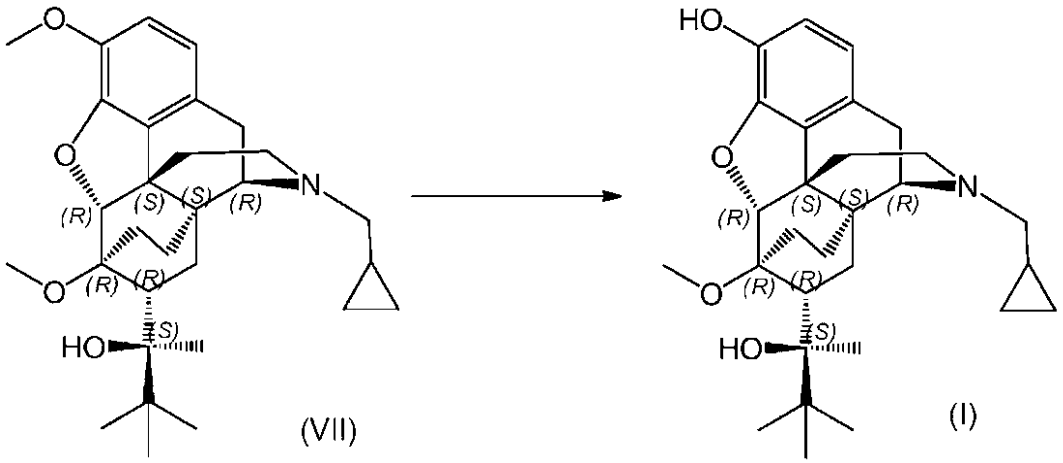
またはその薬学的に許容可能な塩を調製するプロセスにおいて、

【化２】



無機塩基の存在下で、第１の有機溶媒中、約４０℃～約７０℃の範囲の温度で、式（Ｖ）の化合物を式（ＶＩ）の化合物と反応させて、式（ＶＩＩ）の対応化合物を生じることであって、式中、Ｌ^{1}は、脱離基であり、前記無機塩基は、酸と反応または接触したときに水を形成しない、ことと、

【化３】



塩基の存在下で、第２の有機溶媒中、約１１０℃～約１５０℃の範囲の温度で、不活性雰囲気下で、式（ＶＩＩ）の化合物を脱メチル化剤と反応させて、式（Ｉ）の対応化合物を生じることと、

を含む、プロセス。

【請求項２】

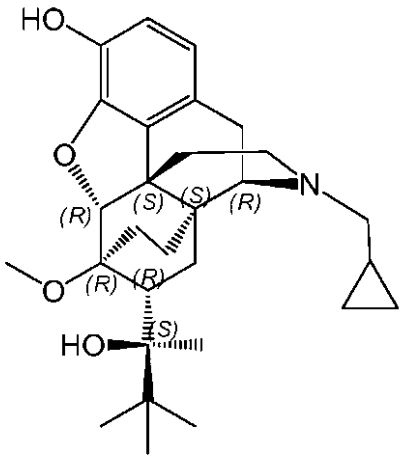
請求項１に記載のプロセスにおいて、

前記式（ＶＩＩ）の化合物は、単離されない、プロセス。

【請求項３】

式（Ｉ）の化合物

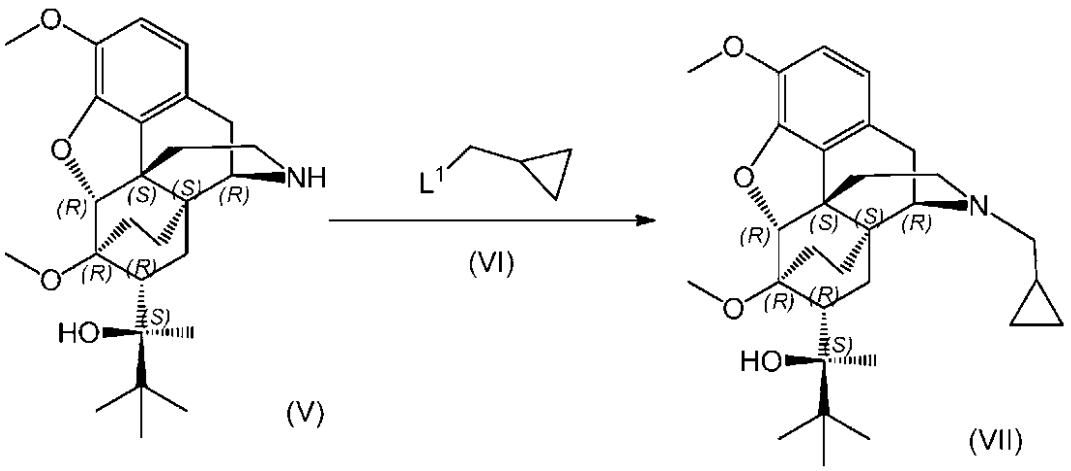
【化４】



(I)

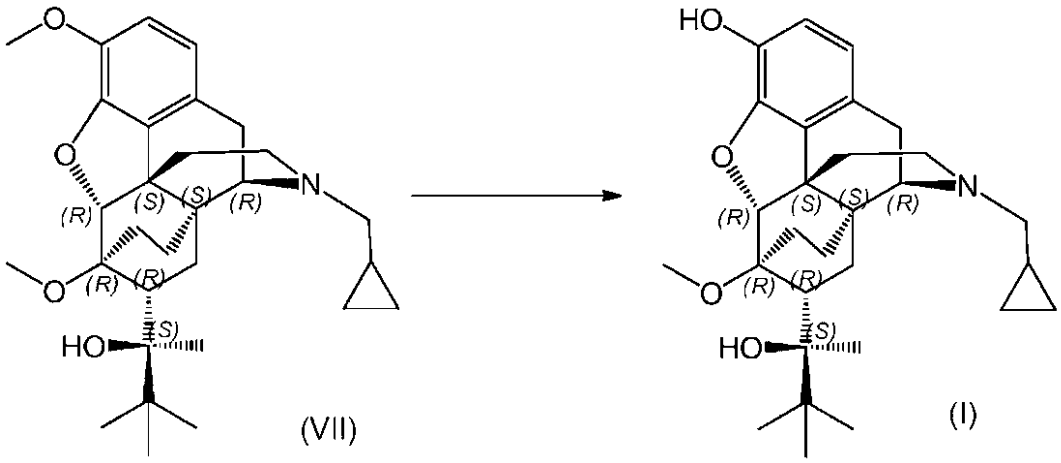
またはその薬学的に許容可能な塩を調製するプロセスにおいて、

【化５】



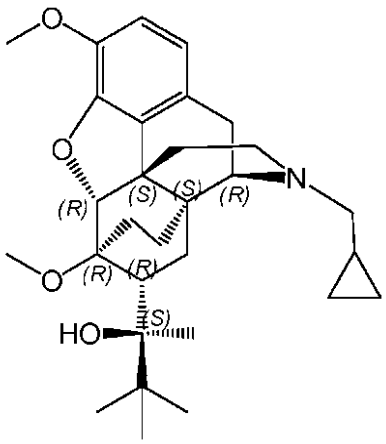
無水のK_2HPO_4の存在下で、ＤＭＦ中、約６０℃の温度で、式（Ｖ）の化合物を、式（ＶＩ）の化合物と反応させて、式（ＶＩＩ）の対応化合物を生じることであって、式中、L^1は臭素であり、前記式（ＶＩ）の化合物は、約１．４モル当量の量で存在し、前記無水のK_2HPO_4は、約２．４～約３モル当量の範囲の量で存在する、ことと、

【化６】



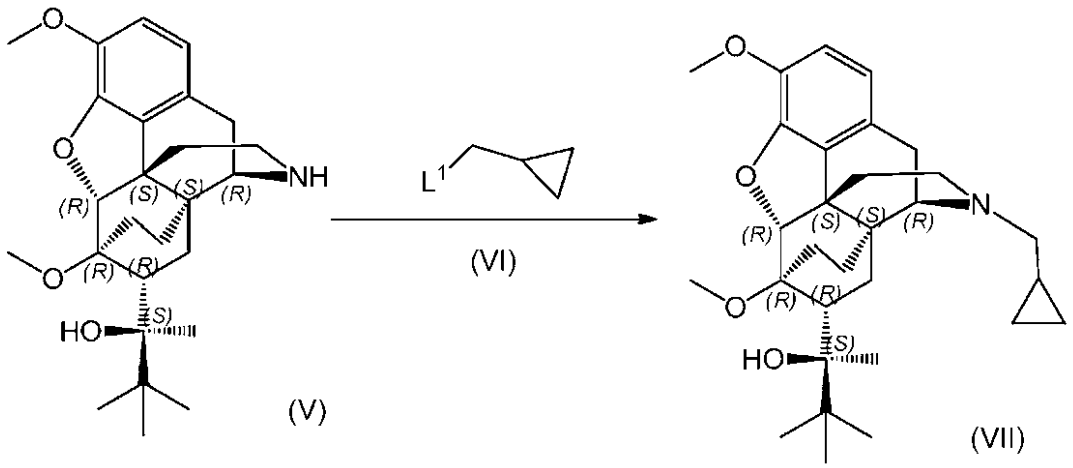
ＮａＯｔＢｕの存在下で、ＤＭＦ中、約１３１℃の温度で、不活性雰囲気下で、式（ＶＩＩ）の化合物を、ｔｅｒｔ‐ドデシルメルカプタンと反応させて、式（Ｉ）の対応化合物を生じることであって、前記ｔｅｒｔ‐ドデシルメルカプタンは、約３．１モル当量の

量で存在し、前記ＮａＯｔＢｕは、約３．１モル当量の量で存在する、ことと、
を含む、プロセス。
【請求項４】
式（ＶＩＩ）の化合物
【化７】



(VII)

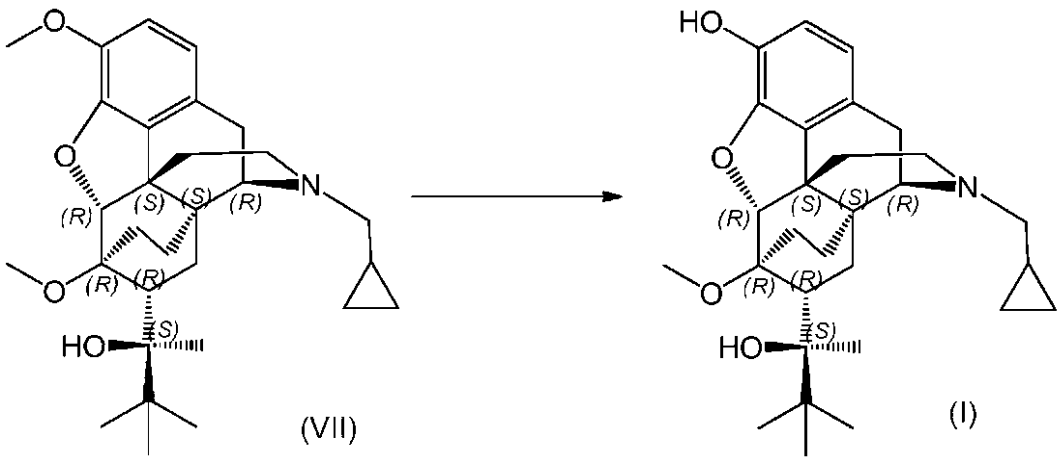
またはその薬学的に許容可能な塩を調製するプロセスにおいて、
【化８】



(V) (VI) (VII)

無機塩基の存在下で、第１の有機溶媒中、約４０℃～約７０℃の範囲の温度で、式（Ｖ）の化合物を、式（ＶＩ）の化合物と反応させて、式（ＶＩＩ）の対応化合物を生じることであって、式中、L^1は脱離基であり、前記無機塩基は、酸と反応または接触したときに水を形成しない、こと、
を含む、プロセス。
【請求項５】
請求項４に記載のプロセスにおいて、
L^1は臭素であり、
前記式（ＶＩ）の化合物は、約１．４モル当量の量で存在し、
前記無機塩基は、無水のK_2HPO_4であり、
前記無水のK_2HPO_4は、約２．４～約３モル当量の範囲の量で存在し、
前記第１の有機溶媒は、ＤＭＦであり、
前記式（Ｖ）の化合物は、約６０℃の温度で、前記式（ＶＩ）の化合物と反応させられる、プロセス。
【請求項６】
請求項４に記載のプロセスにおいて、

【化９】

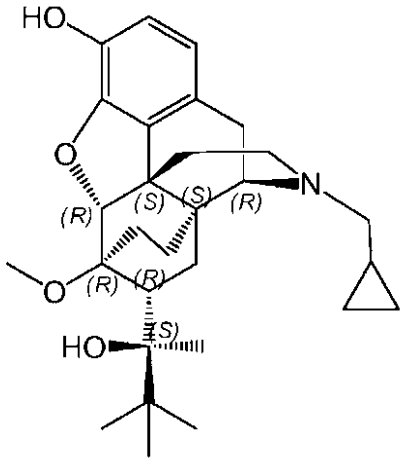


塩基の存在下で、第２の有機溶媒中、約１１０℃～約１５０℃の範囲の温度で、不活性雰囲気下で、前記式（ＶＩＩ）の化合物を脱メチル化剤と反応させて、式（Ｉ）の対応化合物を生じることをさらに含む、プロセス。

【請求項７】

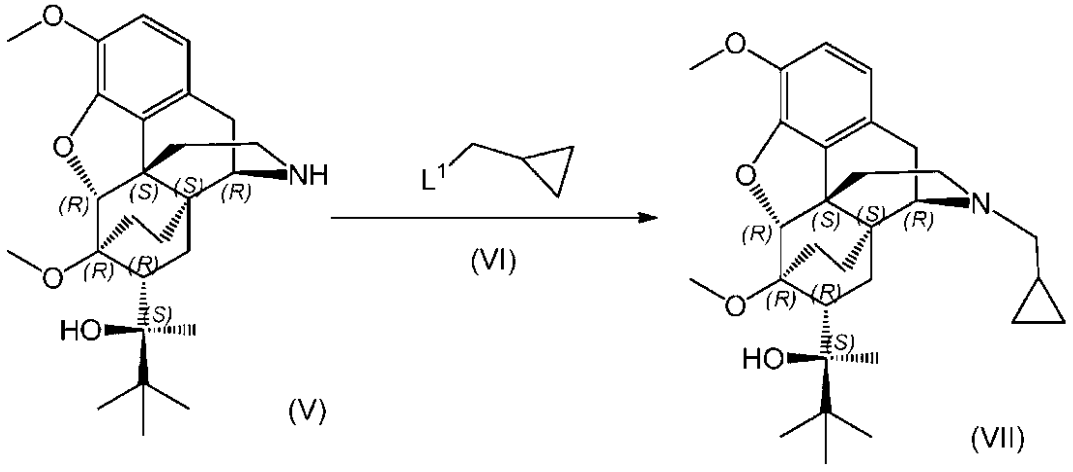
式（Ｉ）の化合物

【化１０】



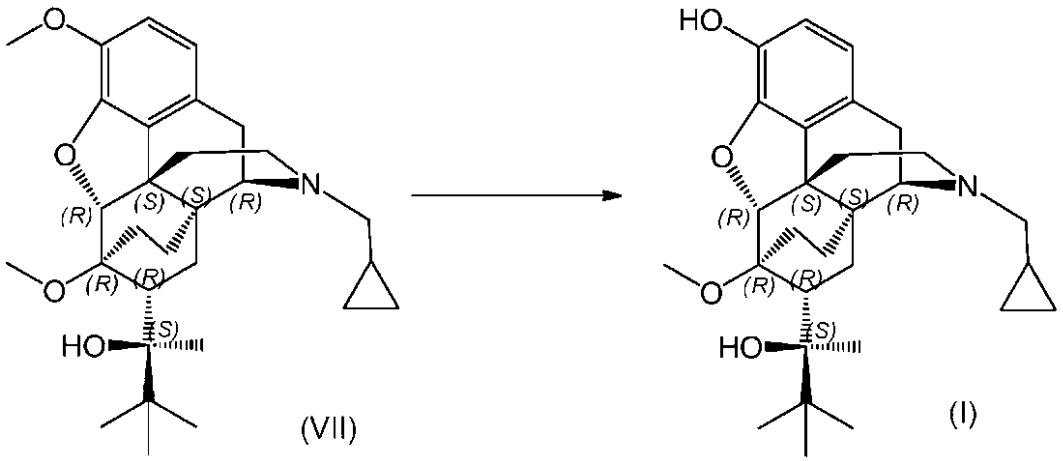
またはその薬学的に許容可能な塩を調製するプロセスにおいて、

【化１１】

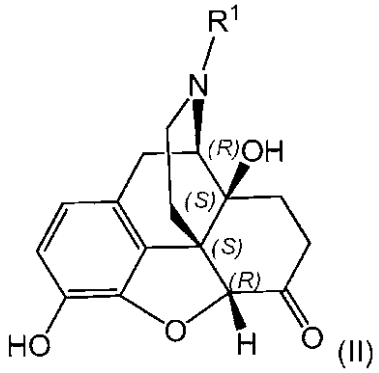


無機塩基の存在下で、第１の有機溶媒中、約４０℃～約７０℃の範囲の温度で、式（Ｖ）の化合物を、式（ＶＩ）の化合物と反応させて、式（ＶＩＩ）の対応化合物を生じることであって、式中、Ｌ^{1}は脱離基であり、前記無機塩基は、酸と反応または接触したとき

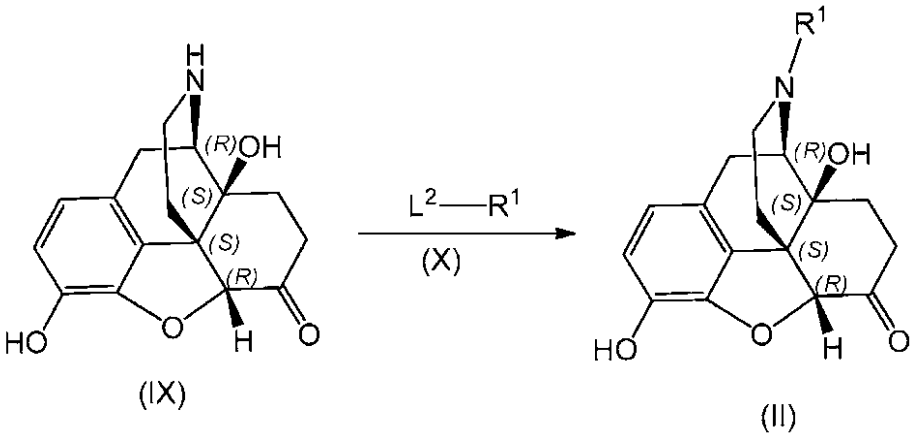
に水を形成しない、ことと、
【化１２】



前記式（ＶＩＩ）の化合物を反応させて、式（Ｉ）の対応化合物を生じることと、
を含む、プロセス。
【請求項８】
式（ＩＩ）の化合物
【化１３】

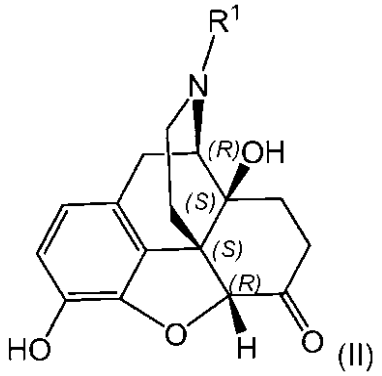


またはその薬学的に許容可能な塩を調製するプロセスであって、
式中、R^1は、－CH_2－（シクロプロピル）、－CH_2－（シクロブチル）、および－CH_2－CH＝CH_2からなる群から選択される、プロセスにおいて、
【化１４】



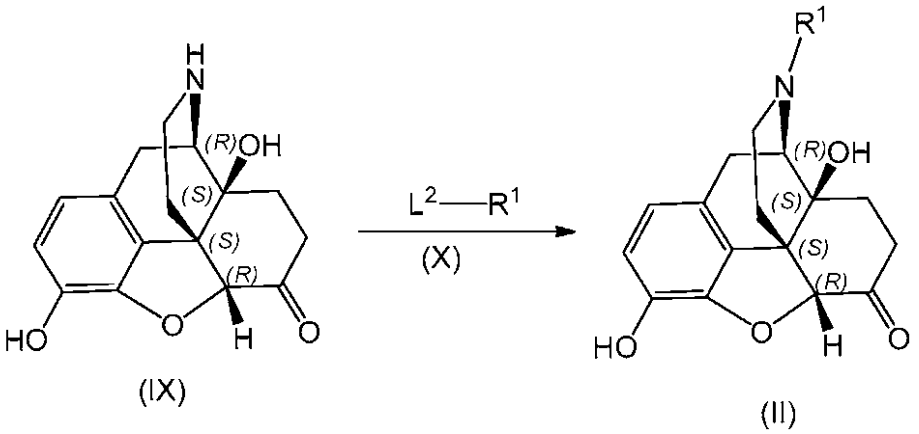
無機塩基の存在下で、第１の有機溶媒中、約４０℃～約７０℃の範囲の温度で、式（ＩＸ）の化合物を式（Ｘ）の化合物と反応させて、式（ＩＩ）の対応化合物を生じることであって、式中、L^2は、脱離基であり、前記無機塩基は、酸と反応または接触したときに水を形成しない、こと、
を含む、プロセス。

【請求項９】
請求項８に記載のプロセスにおいて、
前記式（Ｘ）の化合物は、約１．１～約２．５モル当量の範囲の量で存在する、プロセス。
【請求項１０】
請求項８に記載のプロセスにおいて、
前記式（Ｘ）の化合物は、約１．２５～約１．７５モル当量の範囲の量で存在する、プロセス。
【請求項１１】
請求項８に記載のプロセスにおいて、
前記無機塩基は、選択的に、前記式（ＩＸ）の化合物上で遊離フェノールをプロトン化しない塩基である、プロセス。
【請求項１２】
請求項８に記載のプロセスにおいて、
前記式（ＩＸ）の化合物は、プロモーターの存在下で前記式（Ｘ）の化合物と反応させられる、プロセス。
【請求項１３】
請求項１２に記載のプロセスにおいて、
前記プロモーターは、ＮａＩであり、
前記ＮａＩは、約５モル％～約１０モル％の範囲の量で存在する、プロセス。
【請求項１４】
請求項８に記載のプロセスにおいて、
R^1は、－CH_2－（シクロプロピル）、－CH_2－（シクロブチル）、または－CH_2－$CH=CH_2$である、プロセス。
【請求項１５】
式（ＩＩ）の化合物
【化１５】



またはその薬学的に許容可能な塩を調製するプロセスであって、
式中、R^1は、－CH_2－（シクロプロピル）、および－CH_2－$CH=CH_2$からなる群から選択される、プロセスにおいて、

【化１６】



(IX) (II)

無水のK_2HPO_4の存在下で、ＤＭＦ中、約６０℃の温度で、式（ＩＸ）の化合物を式（Ｘ）の化合物と反応させて、式（ＩＩ）の対応化合物を生じることであって、式中、L^1は臭素であり、前記式（Ｘ）の化合物は、約１．４モル当量の量で存在し、前記無水のK_2HPO_4は、約２．４～約３モル当量の範囲の量で存在する、こと、

を含む、プロセス。

【請求項１６】

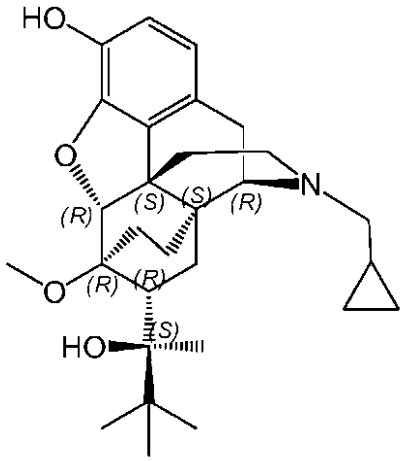
請求項１５に記載のプロセスにおいて、

R^1は、－CH_2－（シクロプロピル）、－CH_2－（シクロブチル）、または－CH_2－$CH=CH_2$である、プロセス。

【請求項１７】

本明細書に記載されたような、式（Ｉ）の化合物

【化１７】



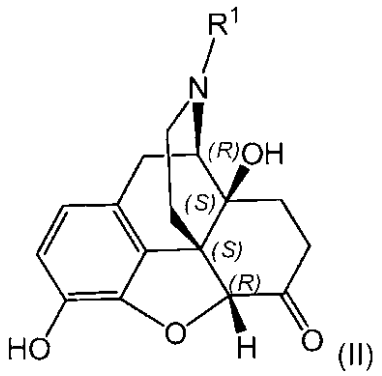
(I)

またはその薬学的に許容可能な塩を調製するプロセス。

【請求項１８】

本明細書に記載されたような、式（ＩＩ）の化合物

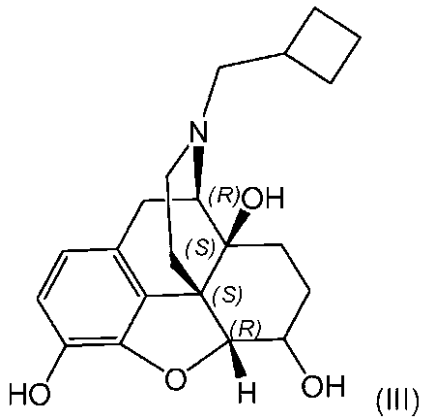
【化１８】



またはその薬学的に許容可能な塩を調製するプロセスにおいて、
式中、Ｒ^{1}は、‐ＣＨ$_{2}$‐（シクロプロピル）、‐ＣＨ$_{2}$‐（シクロブチル）、および‐ＣＨ$_{2}$‐ＣＨ＝ＣＨ$_{2}$からなる群から選択される、プロセス。

【請求項１９】
本明細書に記載されたような、式（ＩＩＩ）の化合物

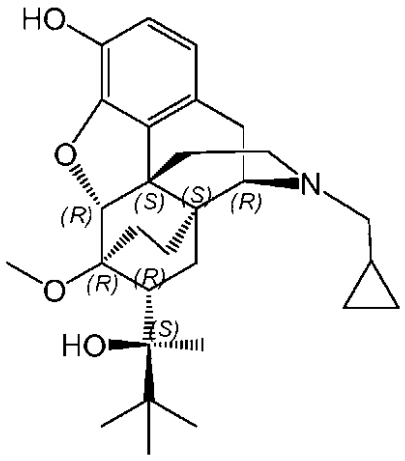
【化１９】



またはその薬学的に許容可能な塩を調製するプロセス。

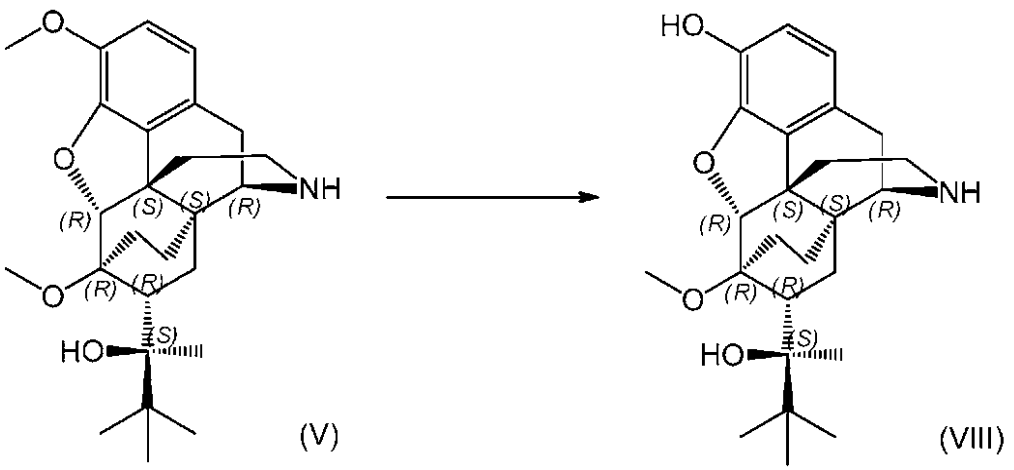
【請求項２０】
式（Ｉ）の化合物

【化２０】



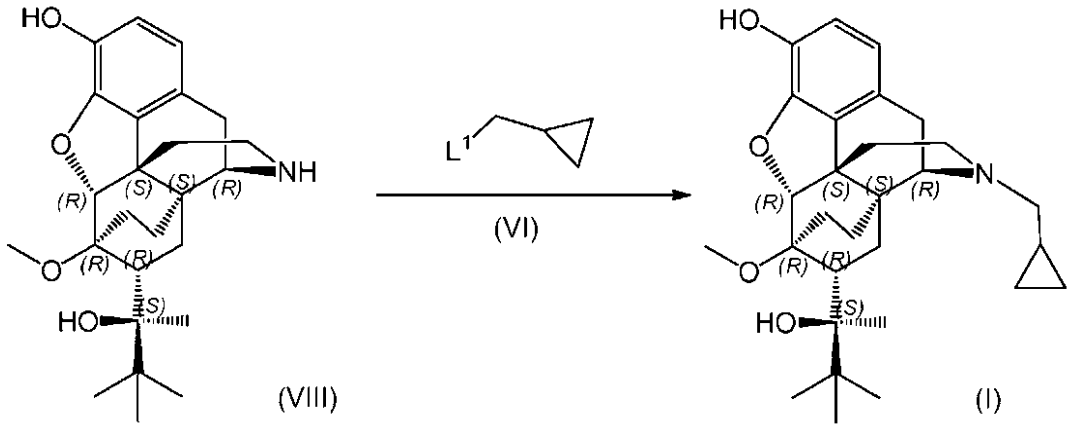
またはその薬学的に許容可能な塩を調製するプロセスにおいて、

【化２１】



塩基の存在下で、第１の有機溶媒中、約１１０℃～約１５０℃の範囲の温度で、不活性雰囲気下で、式（Ｖ）を脱メチル化剤と反応させて、式（ＶＩＩＩ）の対応化合物を生じることと、

【化２２】



無機塩基の存在下で、第２の有機溶媒中、約４０℃～約７０℃の範囲の温度で、前記式（ＶＩＩＩ）の化合物を、式（ＶＩ）の化合物と反応させて、式（Ｉ）の対応化合物を生じることであって、式中、L^1は脱離基であり、前記無機塩基は、酸と反応または接触したときに水を形成せず、前記第２の有機溶媒は、前記第１の有機溶媒と同じである、ことと、

を含む、プロセス。

【請求項２１】

請求項１または２０に記載のプロセスにおいて、

前記脱メチル化剤は、ｔｅｒｔ‐ドデシルメルカプタンであり、

前記塩基は、アルコキシド塩基である、プロセス。

【請求項２２】

請求項２１に記載のプロセスにおいて、

前記アルコキシド塩基は、ＮａＯｔＢｕである、プロセス。

【請求項２３】

請求項１または２０に記載のプロセスにおいて、

前記脱メチル化剤は、約２．５～約４モル当量、または約２．８～約３．４モル当量の範囲の量で存在する、プロセス。

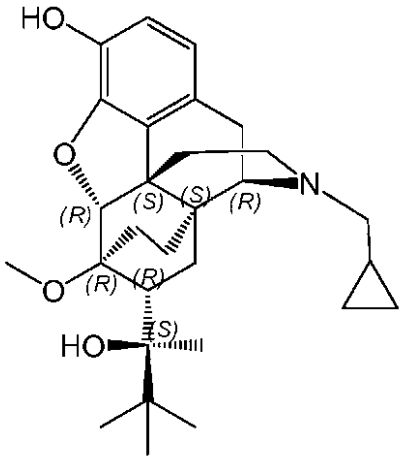
【請求項２４】

請求項１または２０に記載のプロセスにおいて、

前記塩基は、約２．５～約４モル当量、または約２．８～約３．４モル当量の範囲の量

で存在する、プロセス。
【請求項２５】
請求項１、８、または２０に記載のプロセスにおいて、
前記第１の有機溶媒は、ＤＭＦである、プロセス。
【請求項２６】
請求項２０に記載のプロセスにおいて、
前記式（ＶＩＩＩ）の化合物は、単離されない、プロセス。
【請求項２７】
請求項１、８、または２０に記載のプロセスにおいて、
L^1は臭素である、プロセス。
【請求項２８】
請求項１または２０に記載のプロセスにおいて、
前記式（ＶＩ）の化合物は、約１．１～約２．５モル当量、または約１．２５～約１．７５モル当量の範囲の量で存在する、プロセス。
【請求項２９】
請求項１、８、または２０に記載のプロセスにおいて、
前記無機塩基は、無水無機塩基である、プロセス。
【請求項３０】
請求項２９に記載のプロセスにおいて、
前記無機塩基は、無水のK_2HPO_4である、プロセス。
【請求項３１】
請求項１、８、または２０に記載のプロセスにおいて、
前記無機塩基は、約２～約４モル当量、または約２．２５～約３．２５モル当量の範囲の量で存在する、プロセス。
【請求項３２】
請求項１または２０に記載のプロセスにおいて、
前記式（Ｖ）の化合物は、プロモーターの存在下で前記式（ＶＩ）の化合物と反応させられる、プロセス。
【請求項３３】
請求項３２に記載のプロセスにおいて、
前記プロモーターは、ＮａＩであり、
前記ＮａＩは、約５モル％～約１０モル％の範囲の量で存在する、プロセス。
【請求項３４】
請求項２０に記載のプロセスにおいて、
前記無機塩基は、選択的に、前記式（ＶＩＩＩ）の化合物上の遊離フェノールをプロトン化しない塩基である、プロセス。
【請求項３５】
請求項１または２０に記載のプロセスにおいて、
前記式（Ｉ）の化合物をＨＣｌと反応させて、前記式（Ｉ）の化合物の対応する塩酸塩を生じることをさらに含む、プロセス。
【請求項３６】
式（Ｉ）の化合物

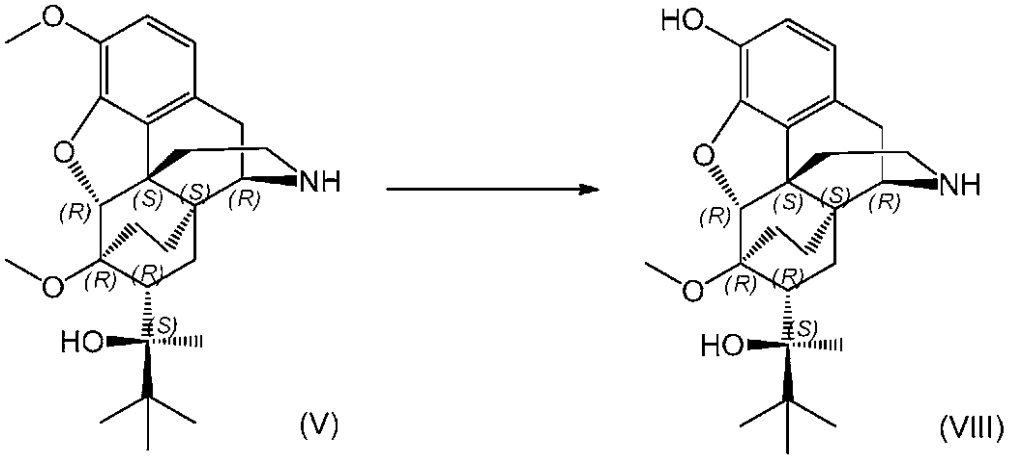
【化２３】



(I)

またはその薬学的に許容可能な塩を調製するプロセスにおいて、

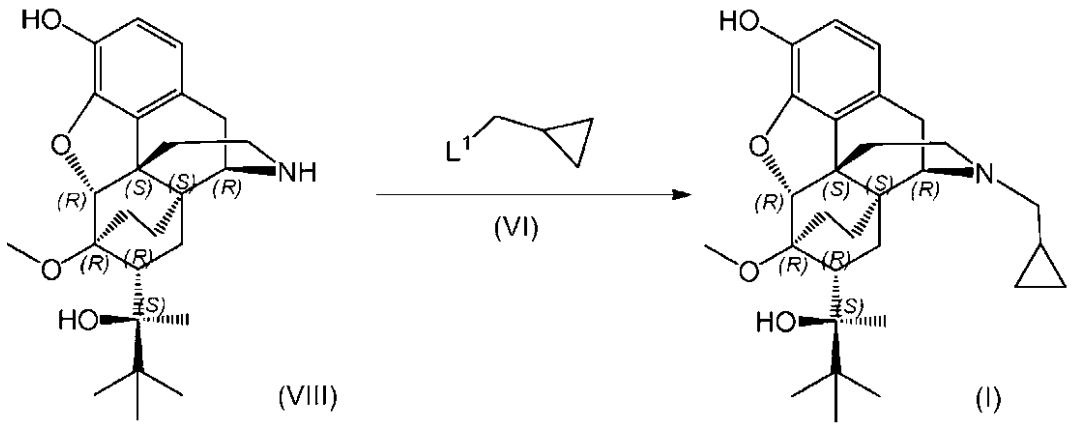
【化２４】



(V) (VIII)

ＮａＯｔＢｕの存在下で、ＤＭＦ中、約１３１℃の温度で、不活性雰囲気下で、式（Ｖ）の化合物をｔｅｒｔ‐ドデシルメルカプタンと反応させて、式（ＶＩＩＩ）の対応化合物を生じることであって、前記ｔｅｒｔ‐ドデシルメルカプタンは、約３．１モル当量の量で存在し、前記ＮａＯｔＢｕは、約３．１モル当量の量で存在する、ことと、

【化２５】



(VIII) (VI) (I)

無水のK_2HPO_4の存在下で、ＤＭＦ中、約６０℃の温度で、前記式（ＶＩＩＩ）の化合物を式（ＶＩ）の化合物と反応させて、式（Ｉ）の対応化合物を生じることであって、式中、L^1は臭素であり、前記式（ＶＩ）の化合物は、約１．４モル当量の量で存在し、前記無水のK_2HPO_4は、約２．４～約３モル当量の範囲の量で存在する、ことと、

を含む、プロセス。