

【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3月6日(2014.3.6)

【公表番号】特表2013-518093(P2013-518093A)

【公表日】平成25年5月20日(2013.5.20)

【年通号数】公開・登録公報2013-025

【出願番号】特願2012-550526(P2012-550526)

【国際特許分類】

C 07 D 498/18 (2006.01)

A 61 K 31/436 (2006.01)

A 61 P 35/00 (2006.01)

【F I】

C 07 D 498/18

A 61 K 31/436

A 61 P 35/00

【手続補正書】

【提出日】平成26年1月17日(2014.1.17)

【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

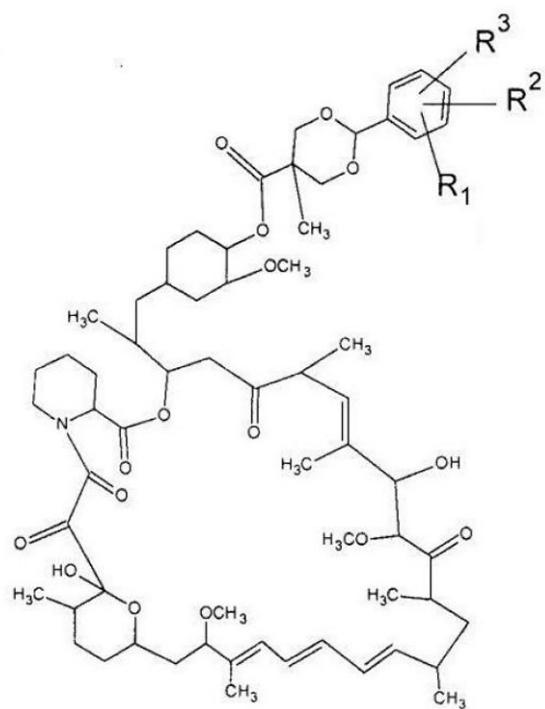
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)で表され、式中R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>およびR<sub>3</sub>が各々異なっていても同一であってもよく、水素、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>炭素原子のアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>炭素原子のアルコキシからなる群から選択される化合物。

【化1】

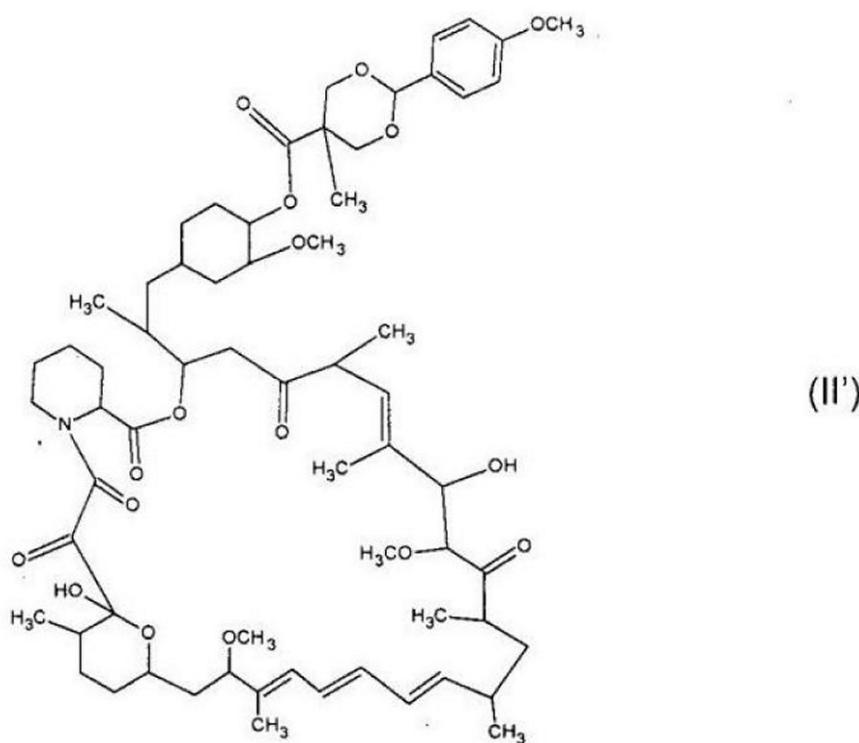


(II)

【請求項2】

式(I I')

【化2】

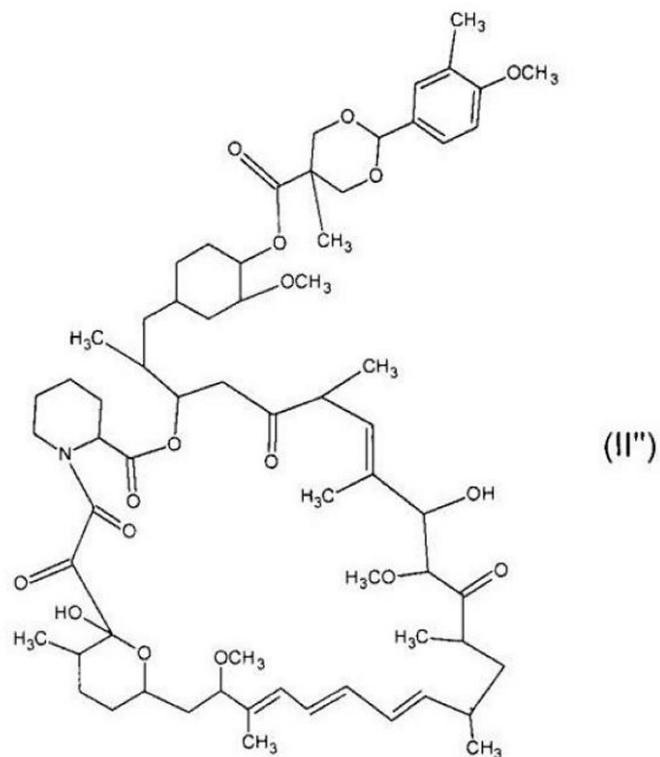


で表される化合物。

【請求項3】

式 ( I I ' ' )

【化 3】

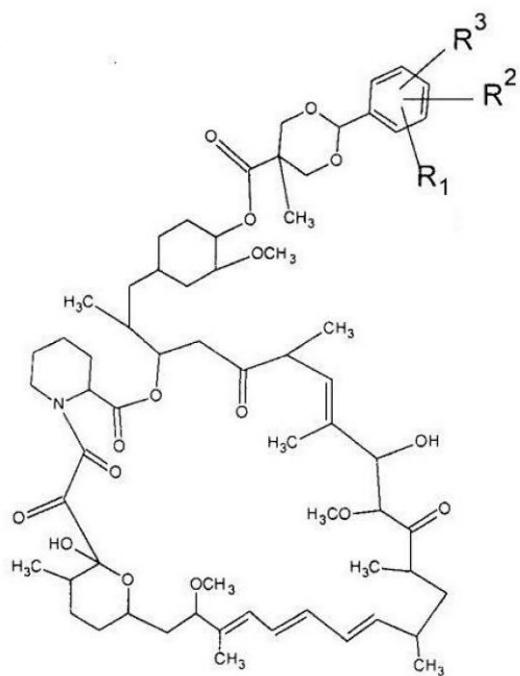


で表される化合物。

【請求項 4】

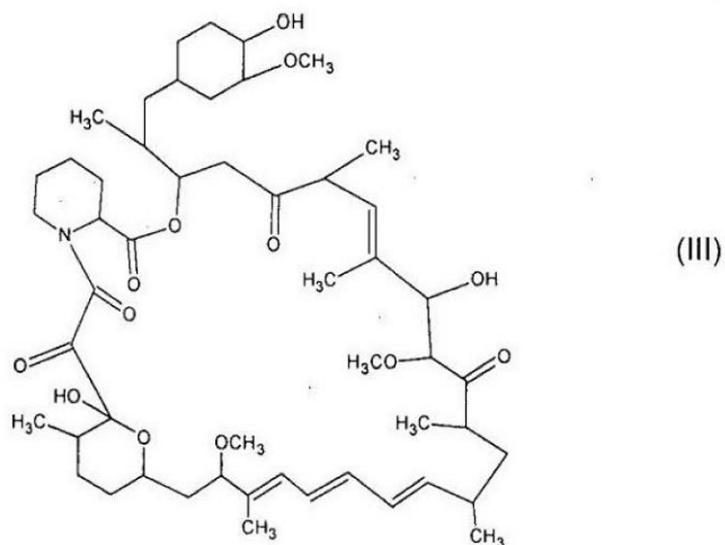
式 I I で表される化合物の製造方法であって、式 ( I I I ) で表されるラパマイシンを式 ( I V ) で表される化合物で処理することを含み、式中  $R_1$ 、 $R_2$  および  $R_3$  が各々異なっていても同一であってもよく、水素、 $C_1$  ~  $C_4$  炭素原子のアルキル、 $C_1$  ~  $C_4$  炭素原子のアルコキシからなる群から選択される、前記方法。

## 【化4】

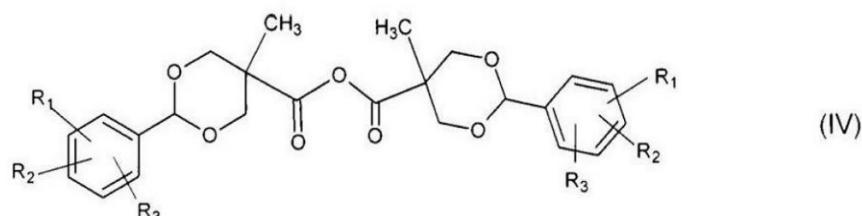


(II)

## 【化5】



## 【化6】



## 【請求項5】

ラパマイシンの式 (IV) で表される化合物との反応を、塩化工チレン、塩化メチレン、四塩化炭素およびその混合物から選択されたハロゲン化炭化水素からなる群から選択さ

れた適切な溶媒の存在下で行う、請求項4に記載の方法。

【請求項 6】

ラパマイシンの式(IV)で表される化合物との反応を、触媒量のジメチルアミノピリジンまたは4-ピロリジノピリジンの存在下で行う、請求項4に記載の方法。

【請求項 7】

ラパマイシンの式(IV)で表される化合物との反応を、-20～室温の温度範囲にて行う、請求項4に記載の方法。

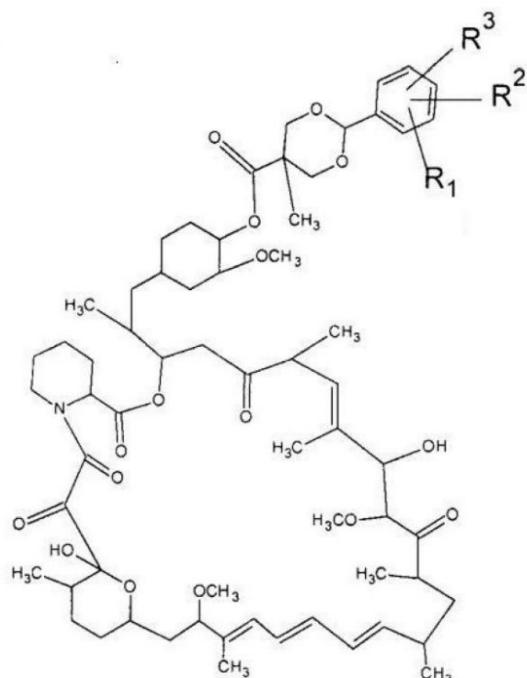
【請求項 8】

ラパマイシンの式(IV)で表される化合物との反応を、6～24時間行う、請求項4に記載の方法。

【請求項 9】

テムシロリムスの製造方法であって、式(II)

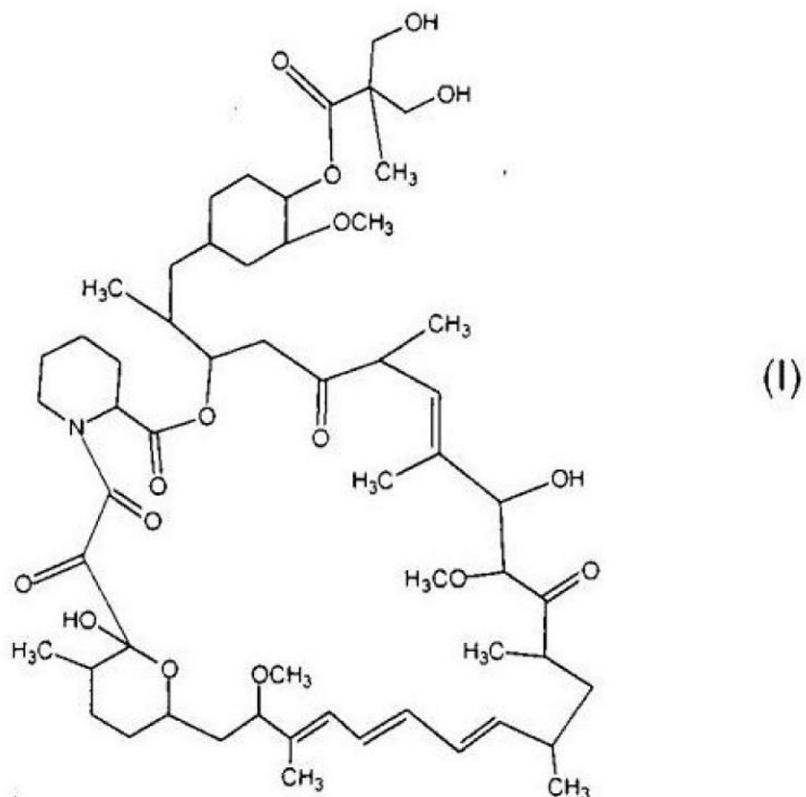
【化7】



(II)

式中 R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub> および R<sub>3</sub> が各々異なっていても同一であってもよく、水素、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>炭素原子のアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>炭素原子のアルコキシからなる群から選択される、で表される化合物を式(I)

【化 8】



で表されるテムシロリムスに変換することを含む、前記方法。

【請求項 1 0】

式 ( I I ) で表される化合物のテムシロリムスへの変換を、硫酸、塩酸およびその混合物からなる群から選択された酸の存在下で行う、請求項 9 に記載の方法。

【請求項 1 1】

式 ( I I ) で表される化合物のテムシロリムスへの変換を、メタノール、エタノール、プロパノール、ブタノールおよびその混合物から選択されたアルコール；テトラヒドロフラン、ジオキサンおよびその混合物から選択されたエーテルからなる群から選択された適切な溶媒の存在下で行う、請求項 9 に記載の方法。

【請求項 1 2】

式 ( I I ) で表される化合物のテムシロリムスへの変換を、-20 ~ 室温の温度範囲にて行う、請求項 9 に記載の方法。

【請求項 1 3】

式 ( I I ) で表される化合物のテムシロリムスへの変換を、6 ~ 24 時間行う、請求項 9 に記載の方法。