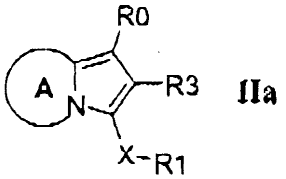
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】平成18年10月19日(2006.10.19)

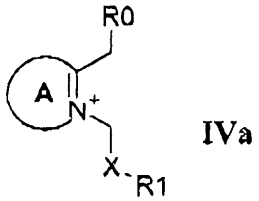
【公表番号】特表2006-504692(P2006-504692A)
【公表日】平成18年2月9日(2006.2.9)
【年通号数】公開・登録公報2006-006
【出願番号】特願2004-536391(P2004-536391)
【国際特許分類】
Ｃ０７Ｄ 471/04 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 9/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 9/08 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 9/10 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 31/04 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 35/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 43/00 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/437 (2006.01)
【ＦＩ】
Ｃ０７Ｄ 471/04 １０４Ａ
Ａ６１Ｐ 9/00
Ａ６１Ｐ 9/08
Ａ６１Ｐ 9/10
Ａ６１Ｐ 31/04
Ａ６１Ｐ 35/00
Ａ６１Ｐ 43/00 １０５
Ａ６１Ｋ 31/437

【手続補正書】
【提出日】平成18年8月31日(2006.8.31)
【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】
環Aが無置換または置換アリール基である、構造式IIaで表される化合物



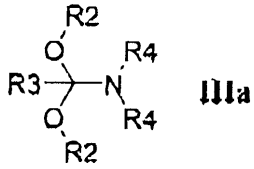
IIa

の製造方法であって、
構造式IVaで表される化合物



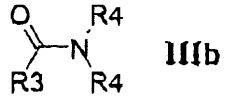
IVa

を、
構造式IIIaで表される化合物



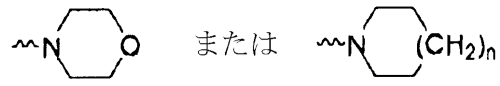
IIIa

または
構造式IIIbで表される化合物



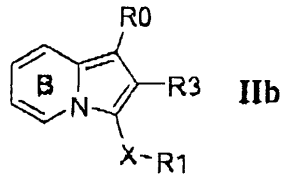
IIIb

をアルキル化剤と反応させることにより調製される試薬
のいずれかと反応させる段階を含む方法：
式中、
Xは共有結合であるか、またはメタノン、スルホン、スルホキシド、置換もしくは無置換アミン、または置換もしくは無置換メチレンから選択される連結基であり；
R0は-H、置換もしくは無置換脂肪族基、置換もしくは無置換アリール基、置換もしくは無置換非芳香族複素環基、ハロゲン、-CN、$-COR^a$、$-CO_2R^a$、$-CONR^aR^b$、$-SO_2R^a$、または$-SO_2NR^aR^b$であり；
R1は-H、置換もしくは無置換脂肪族基、置換もしくは無置換アリール基、置換もしくは無置換非芳香族複素環基、-CN、$-OR^a$、$-SR^a$、または$-NR^aR^b$であり；
各R2は独立に置換もしくは無置換脂肪族基、または置換もしくは無置換アリール基であるか；または両方のR2基は一緒になって不活性連結基であり；
R3は-H、置換もしくは無置換脂肪族基、置換もしくは無置換アリール基、または電子吸引性もしくは電子供与性基であり、ただしR3が-Hである場合、R2の少なくとも1つは二級もしくは三級アルキル基、または置換もしくは無置換アリール基であり；
各R4は独立に-H、置換もしくは無置換脂肪族基、置換もしくは無置換アリール基であるか；
または両方のR4基はそれらが結合している窒素原子と一緒になって置換もしくは無置換複素環基であり；
R^aおよびR^bは独立に-H、アルキルまたはアリールである。
【請求項２】
Xが共有結合であるか、またはメタノン、スルホンもしくはスルホキシドから選択される連結基である、請求項1記載の方法。
【請求項３】
R0およびR3が独立に-H、または置換もしくは無置換脂肪族基であり、Xがメタノンである、請求項1記載の方法。
【請求項４】
(a) R2が置換もしくは無置換環状脂肪族基、または$-CH(R^c)_2$、$-C(R^c)_3$であり、各R^cは独立にC1～C4アルキル基であり；かつ
(b) 各R4は-H、$-CH_3$、$-CH_2CH_3$、$-CH_2CH_2CH_3$、$-CH(CH_3)_2$、$-C(CH_3)_3$、フェニルであるか；
または両方のR4基はそれらが結合している窒素原子と一緒になって、下記の環状基



であり、式中、nは0、1もしくは2である、請求項3記載の方法。
【請求項５】
環Bが無置換もしくは置換であるか、またはアリール基に縮合されている、構造式IIbで

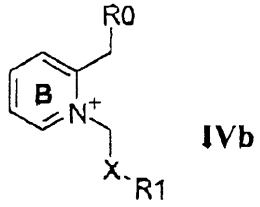
表される化合物



IIb

の製造方法であって、

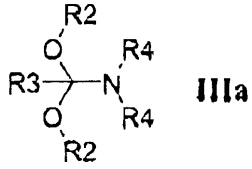
構造式IVbで表される化合物



IVb

を、

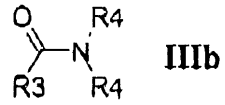
構造式IIIaで表される化合物



IIIa

または

構造式IIIbで表される化合物



IIIb

をアルキル化剤と反応させることにより調製される試薬
のいずれかと反応させる段階を含む方法：

式中、

Xは共有結合であるか、またはメタノン、スルホン、スルホキシド、置換もしくは無置換アミン、または置換もしくは無置換メチレンから選択される連結基であり；

R0は-H、置換もしくは無置換脂肪族基、置換もしくは無置換アリール基、置換もしくは無置換非芳香族複素環基、ハロゲン、-CN、$-COR^a$、$-CO_2R^a$、$-CONR^aR^b$、$-SO_2R^a$、または$-SO_2NR^aR^b$であり；

R1は-H、置換もしくは無置換脂肪族基、置換もしくは無置換アリール基、置換もしくは無置換非芳香族複素環基、-CN、$-OR^a$、$-SR^a$、または$-NR^aR^b$であり；

各R2は独立に置換もしくは無置換脂肪族基、または置換もしくは無置換アリール基であるか；または両方のR2基は一緒になって不活性連結基であり；

R3は-H、置換もしくは無置換脂肪族基、置換もしくは無置換アリール基、または電子吸引性もしくは電子供与性基であり、ただしR3が-Hである場合、R2の少なくとも1つは二級もしくは三級アルキル基、または置換もしくは無置換アリール基であり；

各R4は独立に-H、置換もしくは無置換脂肪族基、または置換もしくは無置換アリール基であるか；

または両方のR4基はそれらが結合している窒素原子と一緒になって置換もしくは無置換複素環基であり；

R^aおよびR^bは独立に-H、アルキルまたはアリールである。

【請求項６】

Xがメタノン、スルホン、またはスルホキシドである、請求項5記載の方法。

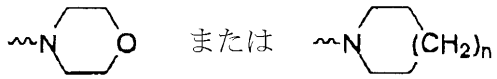
【請求項７】

(a) R2が置換もしくは無置換環状脂肪族基、または置換もしくは無置換フェニル基、ま

たは-CH(R^c)$_2$もしくは-C(R^c)$_3$であり、各R^cは独立にC1～C4アルキル基であり；かつ

(b) 各R4は-H、-CH_3、-CH_2CH_3、-$CH_2CH_2CH_3$、-$CH(CH_3)_2$、-$C(CH_3)_3$、フェニルであるか；

または両方のR4基はそれらが結合している窒素原子と一緒になって、下記の環状基



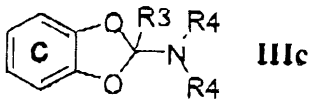
であり、式中、nは0、1もしくは2である、請求項5記載の方法。

【請求項８】

各R2が独立に-$CH(CH_3)_2$、-$C(CH_3)_3$、シクロブチル、2,2',4,4'-テトラメチルシクロブチル、シクロペンチル、2,2',5,5'-テトラメチルシクロペンチル、シクロヘキシル、2,2',6,6'-テトラメチルシクロヘキシル、フェニル、または2,6-ジメチルフェニルであるか；または両方のR2基は一緒になって-($CR5_2$)$_n$-であり、nは1、2または3であり、かつ各R5は独立に-Hまたは-CH_3である、請求項5記載の方法。

【請求項９】

両方のR2基は一緒になって環Cで表され、



IIIc

式中、環Cは無置換または置換である、請求項5記載の方法。

【請求項１０】

構造式IIIbで表される化合物と反応するアルキル化剤が硫酸ジメチルである、請求項6記載の方法。

【請求項１１】

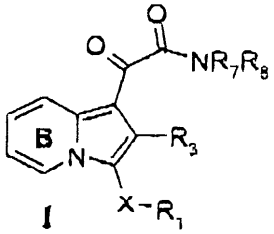
各R2が-$CH(CH_3)_2$であり；各R4が-CH_3であり；かつR0およびR3が両方とも-Hである、請求項10記載の方法。

【請求項１２】

環Bが、任意で、-F、-Cl、-Br、C1～C4アルキル、C1～C4アルコキシ、-C1～C4ハロアルキル、C1～C4ハロアルコキシ、-NH_2、-NO_2、または-CNから選択される1つまたは複数の基で置換されていてもよいか、または環Bは無置換であり、かつR1は-Br、-Cl、-F、-R^a、-OR^a、-CN、-COOR^a、-N(R^a)$_2$、-CON(R^a)$_2$、-NR^aCOR^b、-$NHCONH_2$、または-$SO_2N(R^a)_2$から選択されるゼロ、1つまたは複数の置換基で置換されるフェニル、ピリジル、フラニル、チエニル、ピラゾリル、またはピロリル基である、請求項10記載の方法。

【請求項１３】

構造式IIbで表される化合物を塩化オキサリルまたはその合成等価物とさらに反応させて第一の中間体を製造し；第一の中間体をNHR7R8と反応させて構造式Iで表される化合物を製造する、請求項12記載の方法：

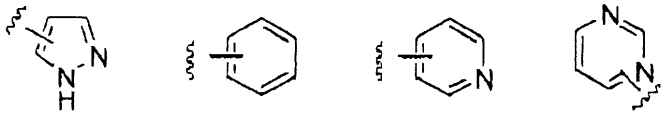


I

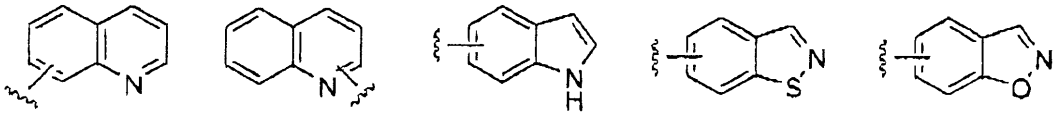
式中、R7およびR8は独立に-H、置換もしくは無置換脂肪族基、置換もしくは無置換非芳香族複素環基、または置換もしくは無置換アリール基であり、ただしR7またはR8は両方が-Hではないか、または、NHR7R8は一緒になって、置換もしくは無置換非芳香族複素環基または置換もしくは無置換アリール基である。

【請求項１４】

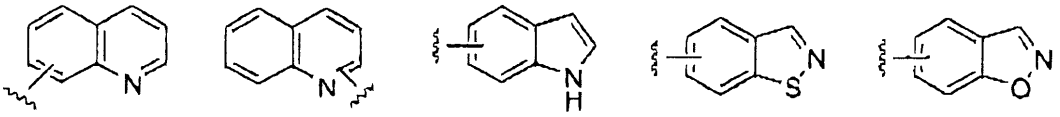
R7がHであり、かつR8が下記から選択される構造式で表される、請求項13記載の方法：



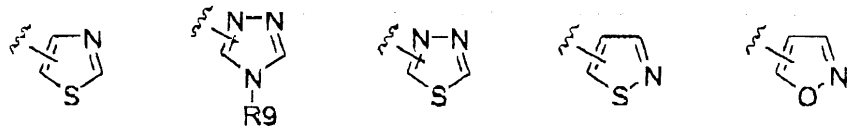
i ii iii iv



v vi vii viii ix



x xi xii xiii xiv

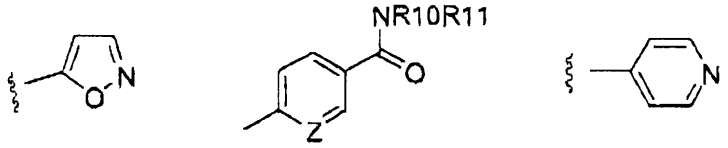


xv xvi xvii xviii xix ;

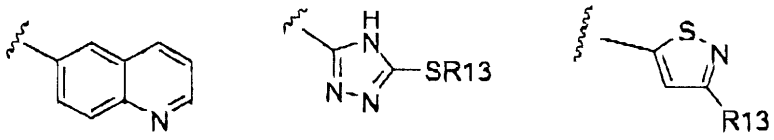
式中、R9は-Hまたは置換もしくは無置換アルキル基である。

【請求項１５】

R8が下記から選択される構造式で表される、請求項14記載の方法：



xx xxi xxii

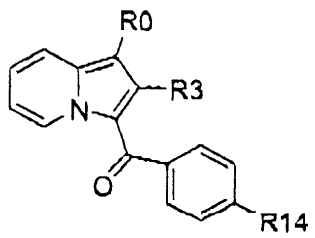


xxiii xxiv xxv

式中、Zは-CH-または-N-であり；R10およびR11は独立に-Hもしくはアルキル基であるか、または-NR10N11は一緒になって非芳香族複素環基であり；かつR13は-Hまたはアルキル基である。

【請求項１６】

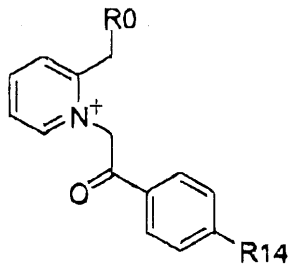
構造式VIIで表される化合物



VII

の製造方法であって、

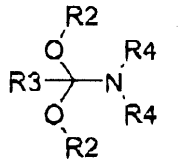
構造式VIIIで表される化合物



VIII

を、

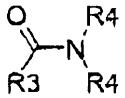
構造式IIIaで表される化合物



IIIa

または

構造式IIIbで表される化合物



IIIb

をアルキル化剤と反応させることにより調製される試薬
のいずれかと反応させる段階を含む方法：

式中、

R2は-C(CH_3)$_3$であり；

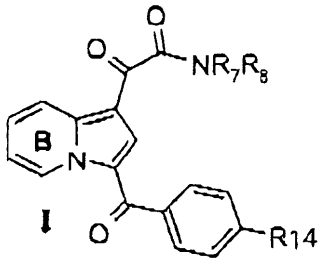
R0およびR3は-Hであり；

R4は-CH_3であり；かつ

R14は-CH_3、-CH_2CH_3、-OCH_3、-CN、Fまたは-Clである。

【請求項１７】

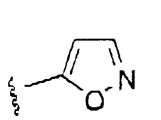
構造式VIIで表される化合物を塩化オキサリルまたはその合成等価物とさらに反応させて第一の中間体を製造し；第一の中間体をNHR7R8と反応させて下記の構造式で表される化合物を製造する、請求項16記載の方法：



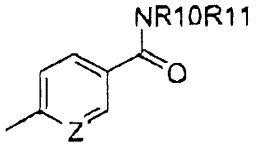
式中、R7およびR8は独立に-H、置換もしくは無置換脂肪族基、置換もしくは無置換非芳香族複素環基、または置換もしくは無置換アリール基であり、ただしR7またはR8は両方が-Hではないか、または、NHR7R8は一緒になって、置換もしくは無置換非芳香族複素環基または置換もしくは無置換アリール基である。

【請求項１８】

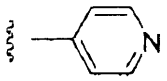
R8が下記から選択される構造式で表される、請求項17記載の方法：



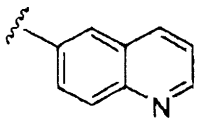
xx



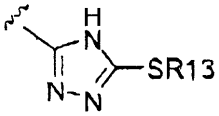
xxi



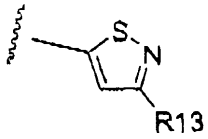
xxii



xxiii



xxiv



xxv

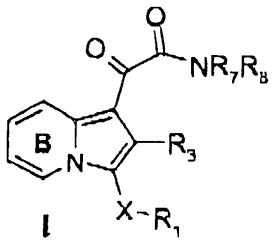
式中、Zは-CH-または-N-であり；R10およびR11は独立に-Hもしくはアルキル基であるか、または-NR10N11は一緒になって非芳香族複素環基であり；R12はアルキル基であり；かつR13は-Hまたはアルキル基である。

【請求項１９】

R8が構造式xxvで表され、かつR13がメチルであり；かつR14が-CNである、請求項26記載の方法。

【請求項２０】

構造式IIbで表される化合物を塩化オキサリルまたはその合成等価物と反応させて第一の中間体を製造する段階；および第一の中間体をNHR7R8と反応させて構造式Iで表される化合物を製造する段階をさらに含み、R0およびR3がHである、請求項5記載の方法：



I

式中、R7およびR8は独立に-H、置換もしくは無置換脂肪族基、置換もしくは無置換非芳香族複素環基、または置換もしくは無置換アリール基であり、ただしR7またはR8は両方が-Hではないか、または、NHR7R8は一緒になって、置換もしくは無置換非芳香族複素環基、または置換もしくは無置換アリール基である。