

【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24年2月2日(2012.2.2)

【公表番号】特表2011-506324(P2011-506324A)

【公表日】平成23年3月3日(2011.3.3)

【年通号数】公開・登録公報2011-009

【出願番号】特願2010-536950(P2010-536950)

【国際特許分類】

C 07 D 313/00 (2006.01)

C 07 D 317/24 (2006.01)

C 07 D 317/22 (2006.01)

C 07 D 493/04 (2006.01)

C 07 D 407/06 (2006.01)

【F I】

C 07 D 313/00

C 07 D 317/24 C S P

C 07 D 317/22

C 07 D 493/04 1 1 1

C 07 D 407/06

【手続補正書】

【提出日】平成23年12月5日(2011.12.5)

【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

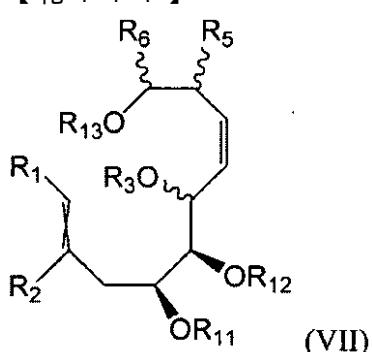
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(VII)：

【化111】



の化合物であって、式(VII)において、

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は各々独立して、水素、C<sub>1～6</sub>アルキル、C<sub>3～6</sub>非共役アルケニルおよびC<sub>3～6</sub>非共役アルキニルからなる群より選択され；

R<sub>3</sub>は、第一の芳香族環を含有する酸素保護基であり；

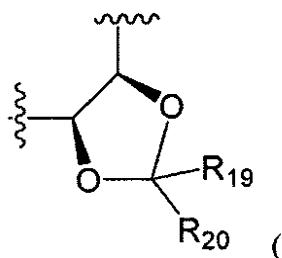
R<sub>5</sub>およびR<sub>6</sub>は各々独立して、水素、ハロゲン、C<sub>1～6</sub>アルキル、C<sub>2～6</sub>アルケニル、C<sub>2～6</sub>アルキニル、C<sub>1～6</sub>ハロアルキル、C<sub>1～6</sub>アルコキシ、フェニルおよびベンジルからなる群より選択され、ここで該フェニルまたはベンジルは、ハロゲン、ヒドロキシリ、C<sub>1～3</sub>アルキル、およびN H<sub>2</sub>から独立して選択される0個、1個、2個、もしくは3個の置換基で置換されているか；あるいは

$R_5$  および  $R_6$  は、これらが結合している炭素と一緒にになって、5員～6員の非共役炭素環式環を形成し；

$R_{11}$  および  $R_{12}$  は、各々独立して、水素および塩基安定性酸素保護基からなる群より選択されるか；または

$R_{11}$  および  $R_{12}$  は一緒にになって、構造(a)：

【化112】

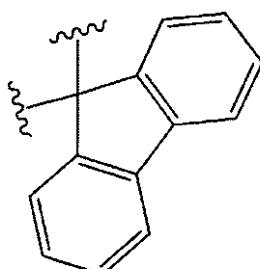


(a)

の5員ヘテロシクリルジイルを形成し；

構造(a)において、 $R_{19}$  および  $R_{20}$  は各々独立して、水素、C<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルコキシおよびフェニルからなる群より選択されるか、または  $R_{19}$  および  $R_{20}$  は一緒にになって、構造(b)：

【化113】



(b)

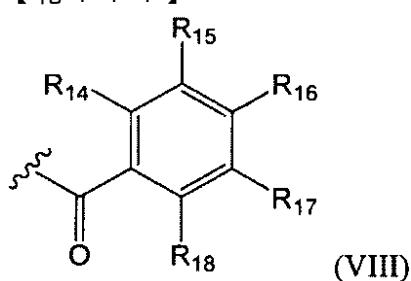
のフルオレニル部分を表し；そして

$R_{13}$  は、第二の芳香族環を含有する酸素保護基である、化合物。

【請求項2】

$R_{13}$  が、

【化114】



(VIII)

であり；そして

$R_{14}$ 、 $R_{15}$ 、 $R_{16}$ 、 $R_{17}$ 、および  $R_{18}$  が各々独立して、H、NO<sub>2</sub>、-NH<sub>3</sub><sup>+</sup>、-COH、-CO(C<sub>1</sub>～<sub>4</sub>アルキル)、-COC<sub>1</sub>、-COOH、-COO(C<sub>1</sub>～<sub>4</sub>アルキル)、-N<sub>3</sub><sup>+</sup>、-SO<sub>3</sub>H、ニトリル、-CF<sub>3</sub> およびハロゲンからなる群より選択される、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

$R_1$  および  $R_2$  が水素である、請求項1および2に記載の化合物。

【請求項4】

$R_3$  が、ベンゾイルまたはベンジルから選択され、ここで該ベンゾイルまたはベンジルの各々は、0個、1個、2個もしくは3個の置換基で置換されており、該置換基は独立し

て、-OH、-O(C<sub>1</sub>~<sub>4</sub>アルキル)、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>~<sub>4</sub>アルキル)、-N(C<sub>1</sub>~<sub>4</sub>アルキル)<sub>2</sub>、アミド、-OCO(C<sub>1</sub>~<sub>4</sub>アルキル)および(C<sub>1</sub>~<sub>4</sub>アルキル)から選択される、請求項1~3のいずれか1項に記載の化合物。

**【請求項5】**

R<sub>3</sub>が4-メトキシベンジルである、請求項1~4のいずれか1項に記載の化合物。

**【請求項6】**

R<sub>5</sub>およびR<sub>6</sub>が独立して、水素およびC<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルキルからなる群より選択される、請求項1~5のいずれか1項に記載の化合物。

**【請求項7】**

R<sub>5</sub>およびR<sub>6</sub>が独立して、水素またはメチルである、請求項1~6のいずれか1項に記載の化合物。

**【請求項8】**

式(VII)の化合物が結晶性である、請求項1~7のいずれか1項に記載の化合物。

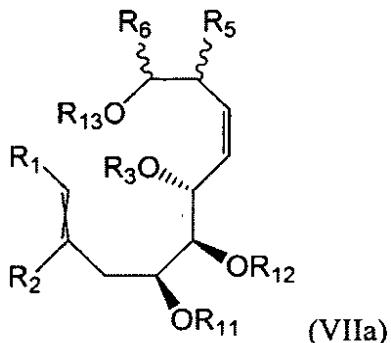
**【請求項9】**

R<sub>1~4</sub>、R<sub>1~5</sub>、R<sub>1~6</sub>、R<sub>1~7</sub>、およびR<sub>1~8</sub>のうちの少なくとも1つが、NO<sub>2</sub>、-NH<sub>3</sub><sup>+</sup>、-COH、-CO(C<sub>1</sub>~<sub>4</sub>アルキル)、-COCl、-COOH、-CO(O(C<sub>1</sub>~<sub>4</sub>アルキル))、-NR<sub>3</sub><sup>+</sup>、-SO<sub>3</sub>H、ニトリル、-CF<sub>3</sub>およびハロゲンからなる群より選択され、そしてR<sub>1~4</sub>、R<sub>1~5</sub>、R<sub>1~6</sub>、R<sub>1~7</sub>、およびR<sub>1~8</sub>のうちの他のものが水素である、請求項1~8のいずれか1項に記載の化合物。

**【請求項10】**

前記式(VII)の化合物が(VIIa)：

**【化115】**

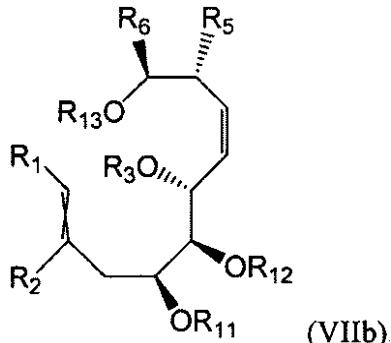


の化合物である、請求項1~9のいずれか1項に記載の化合物。

**【請求項11】**

前記式(VII)の化合物が(VIIb)：

**【化116】**



の化合物である、請求項1~10のいずれか1項に記載の化合物。

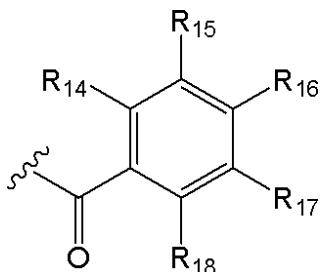
**【請求項12】**

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>が各々独立して水素であり、

R<sub>3</sub>が4-メトキシベンジルであり、

R<sub>5</sub>およびR<sub>6</sub>が各々独立して、水素またはメチルであり、

R<sub>1~3</sub> が、  
【化 1 A】



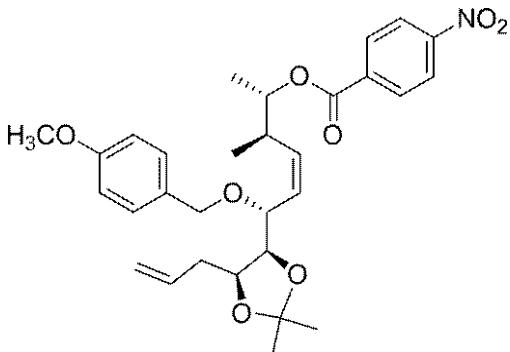
であり；

ここで、R<sub>1~6</sub> は NO<sub>2</sub> であり、R<sub>1~4</sub>、R<sub>1~5</sub>、R<sub>1~7</sub>、および R<sub>1~8</sub> の各々が水素である、請求項 1 1 に記載の化合物。

【請求項 1 3】

以下の構造：

【化 2 A】



を有する、請求項 1 2 に記載の化合物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 0 2 9

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 2 9】

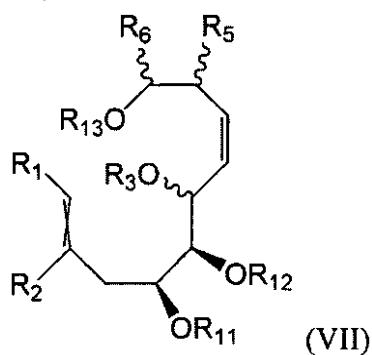
いくつかの実施形態において、R<sub>1</sub> および R<sub>2</sub> は各々独立して、水素である。いくつかの実施形態において、R<sub>3</sub> は 4 - メトキシベンジルである。いくつかの実施形態において、R<sub>5</sub> および R<sub>6</sub> は各々独立して、水素またはメチルである。いくつかの実施形態において、R<sub>1~6</sub> は NO<sub>2</sub> であり、そして R<sub>1~4</sub>、R<sub>1~5</sub>、R<sub>1~7</sub>、および R<sub>1~8</sub> の各々は独立して、水素である。

本発明は、例えば以下の項目を提供する。

(項目 1)

式 (V I I) :

## 【化107】



の中間体であって、式(VII)において、

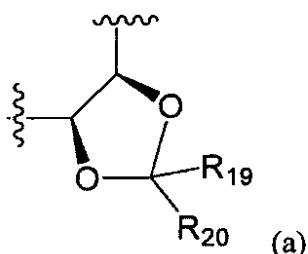
R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は各々独立して、水素、C<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub>～<sub>6</sub>非共役アルケニルおよびC<sub>3</sub>～<sub>6</sub>非共役アルキニルからなる群より選択され；

R<sub>3</sub>は、水素および塩基安定性酸素保護基からなる群より選択され；

R<sub>5</sub>およびR<sub>6</sub>は各々独立して、水素、ハロゲン、C<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～<sub>6</sub>アルキニル、C<sub>1</sub>～<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルコキシ、フェニルおよびベンジルからなる群より選択され、ここで該フェニルまたはベンジルは、ハロゲン、ヒドロキシリル、C<sub>1</sub>～<sub>3</sub>アルキル、およびNH<sub>2</sub>から独立して選択される0個、1個、2個、もしくは3個の置換基で置換されているか；あるいはR<sub>5</sub>およびR<sub>6</sub>は、これらが結合する炭素と一緒にになって、5員～6員の非共役炭素環式環を形成し；

R<sub>11</sub>およびR<sub>12</sub>は、各々独立して、水素および塩基安定性酸素保護基からなる群より選択されるか；またはR<sub>11</sub>およびR<sub>12</sub>は一緒にになって、構造(a)：

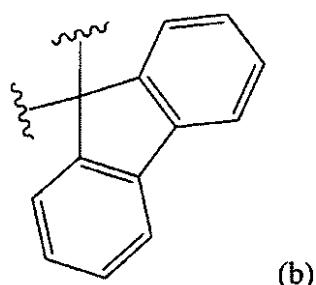
## 【化108】



の5員ヘテロシクリルジイルを形成し；

構造(a)において、R<sub>19</sub>およびR<sub>20</sub>は各々独立して、水素、C<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルコキシおよびフェニルからなる群より選択されるか、またはR<sub>19</sub>およびR<sub>20</sub>は一緒にになって、構造(b)：

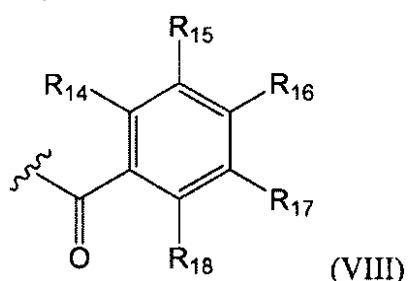
## 【化109】



のフルオレニル部分を表し；そして

R<sub>13</sub>は、

【化110】

であり；そして

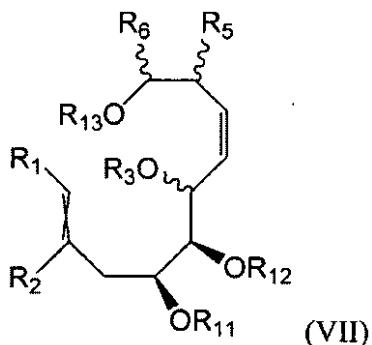
R<sub>1~4</sub>、R<sub>1~5</sub>、R<sub>1~6</sub>、R<sub>1~7</sub>、およびR<sub>1~8</sub>は各々独立して、H、NO<sub>2</sub>、-NH<sub>3</sub><sup>+</sup>、-COH、-CO(C<sub>1~4</sub>アルキル)、-COCl、-COOH、-COO(C<sub>1~4</sub>アルキル)、-N<sub>3</sub><sup>+</sup>、-SO<sub>3</sub>H、ニトリル、-CF<sub>3</sub>およびハロゲンからなる群より選択される。

中間体。(項目2)

R<sub>3</sub>が第一の芳香族環を含有する酸素保護基である、項目1に記載の中間体。

(項目3)式(VII)：

【化111】

の中間体であって、式(VII)において、

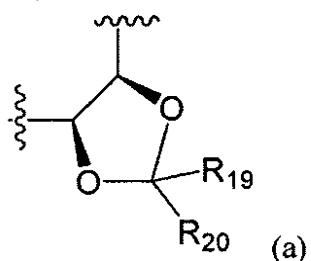
R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は各々独立して、水素、C<sub>1~6</sub>アルキル、C<sub>3~6</sub>非共役アルケニルおよびC<sub>3~6</sub>非共役アルキニルからなる群より選択され；

R<sub>3</sub>は、第一の芳香族環を含有する酸素保護基であり；

R<sub>5</sub>およびR<sub>6</sub>は各々独立して、水素、ハロゲン、C<sub>1~6</sub>アルキル、C<sub>2~6</sub>アルケニル、C<sub>2~6</sub>アルキニル、C<sub>1~6</sub>ハロアルキル、C<sub>1~6</sub>アルコキシ、フェニルおよびベンジルからなる群より選択され、ここで該フェニルまたはベンジルは、ハロゲン、ヒドロキシル、C<sub>1~3</sub>アルキル、およびNH<sub>2</sub>から独立して選択される0個、1個、2個もしくは3個の置換基で置換されているか；あるいはR<sub>5</sub>およびR<sub>6</sub>は、これらが結合している炭素と一緒にになって、5員～6員の非共役炭素環式環を形成し；

R<sub>1~1</sub>およびR<sub>1~2</sub>は、各々独立して、水素および塩基安定性酸素保護基からなる群より選択されるか；またはR<sub>1~1</sub>およびR<sub>1~2</sub>は一緒にになって、構造(a)：

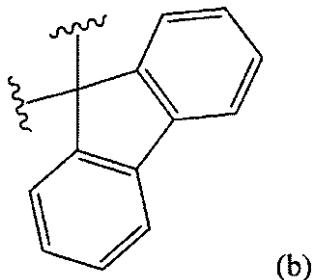
## 【化112】



の5員ヘテロシクリルジイルを形成し；

構造(a)において、R<sub>19</sub>およびR<sub>20</sub>は各々独立して、水素、C<sub>1～6</sub>アルキル、C<sub>1～6</sub>ハロアルキル、C<sub>1～6</sub>アルコキシおよびフェニルからなる群より選択されるか、またはR<sub>19</sub>およびR<sub>20</sub>は一緒になって、構造(b)：

## 【化113】



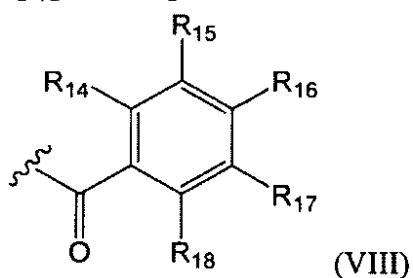
のフルオレニル部分を表し；そして

R<sub>1～3</sub>は、第二の芳香族環を含有する酸素保護基である、中間体。

## (項目4)

R<sub>1～3</sub>が、

## 【化114】



であり；そして

R<sub>1～4</sub>、R<sub>1～5</sub>、R<sub>1～6</sub>、R<sub>1～7</sub>、およびR<sub>1～8</sub>が各々独立して、H、NO<sub>2</sub>、-NH<sub>3</sub><sup>+</sup>、-COH、-CO(C<sub>1～4</sub>アルキル)、-COCl、-COOH、-COO(C<sub>1～4</sub>アルキル)、-NR<sub>3</sub><sup>+</sup>、-SO<sub>3</sub>H、ニトリル、-CF<sub>3</sub>およびハロゲンからなる群より選択される、

項目3に記載の化合物。

## (項目5)

R<sub>1</sub>が水素である、項目1～4のいずれか1項に記載の化合物。

## (項目6)

R<sub>2</sub>が水素である、項目1～5のいずれか1項に記載の化合物。

## (項目7)

R<sub>3</sub>が、ベンゾイルまたはベンジルから選択され、ここで該ベンゾイルまたはベンジル

の各々は、0個、1個、2個もしくは3個の置換基で置換されており、該置換基は独立して、-OH、-O(C<sub>1~4</sub>アルキル)、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1~4</sub>アルキル)、-N(C<sub>1~4</sub>アルキル)、アミド、-OCO(C<sub>1~4</sub>アルキル)および(C<sub>1~4</sub>アルキル)から選択される、項目1~6のいずれか1項に記載の化合物。

(項目8)

R<sub>3</sub>が4-メトキシベンジルである、項目1~7のいずれか1項に記載の化合物。

(項目9)

R<sub>5</sub>が水素およびC<sub>1~6</sub>アルキルからなる群より選択される、項目1~8のいずれか1項に記載の化合物。

(項目10)

R<sub>6</sub>が水素およびC<sub>1~6</sub>アルキルからなる群より選択される、項目1~9のいずれか1項に記載の化合物。

(項目11)

R<sub>5</sub>が水素またはメチルである、項目1~10のいずれか1項に記載の化合物。

(項目12)

R<sub>6</sub>が水素またはメチルである、項目1~11のいずれか1項に記載の化合物。

(項目13)

式(VII)の化合物が結晶性である、項目1~12のいずれか1項に記載の化合物。

(項目14)

R<sub>1~4</sub>、R<sub>1~5</sub>、R<sub>1~6</sub>、R<sub>1~7</sub>、およびR<sub>1~8</sub>のうちの1つは、NO<sub>2</sub>、-NH<sub>3</sub><sup>+</sup>、-COH、-CO(C<sub>1~4</sub>アルキル)、-COC<sub>1</sub>、-COOH、-COO(C<sub>1~4</sub>アルキル)、-NR<sub>3</sub><sup>+</sup>、-SO<sub>3</sub>H、ニトリル、-CF<sub>3</sub>およびハロゲンからなる群より選択され、そしてR<sub>1~4</sub>、R<sub>1~5</sub>、R<sub>1~6</sub>、R<sub>1~7</sub>、およびR<sub>1~8</sub>のうちの他の4つは水素である、項目1~13のいずれか1項に記載の化合物。

(項目15)

R<sub>1~4</sub>、R<sub>1~5</sub>、R<sub>1~6</sub>、R<sub>1~7</sub>、およびR<sub>1~8</sub>のうちの少なくとも1つが、NO<sub>2</sub>、-NH<sub>3</sub><sup>+</sup>、-COH、-CO(C<sub>1~4</sub>アルキル)、-COC<sub>1</sub>、-COOH、-CO(C<sub>1~4</sub>アルキル)、-NR<sub>3</sub><sup>+</sup>、-SO<sub>3</sub>H、ニトリル、-CF<sub>3</sub>およびハロゲンからなる群より選択され、そしてR<sub>1~4</sub>、R<sub>1~5</sub>、R<sub>1~6</sub>、R<sub>1~7</sub>、およびR<sub>1~8</sub>のうちの他のものが水素である、項目1~13のいずれか1項に記載の化合物。

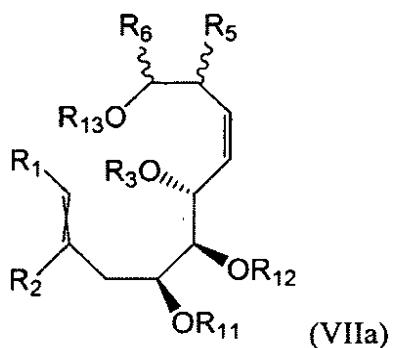
(項目16)

R<sub>1~6</sub>がNO<sub>2</sub>であり、そしてR<sub>1~4</sub>、R<sub>1~5</sub>、R<sub>1~7</sub>、およびR<sub>1~8</sub>の各々が独立して水素である、項目1~13のいずれか1項に記載の化合物。

(項目17)

前記式(VII)の化合物が(VIIa)：

【化115】

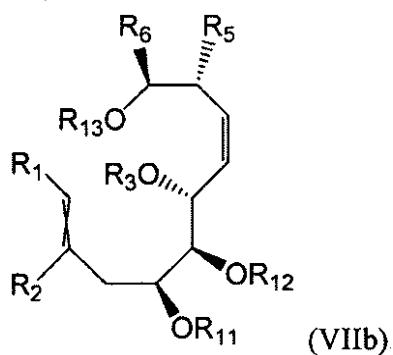


の化合物である、項目1~16のいずれか1項に記載の化合物。

(項目18)

前記式(VII)の化合物が(VIIb)：

## 【化116】

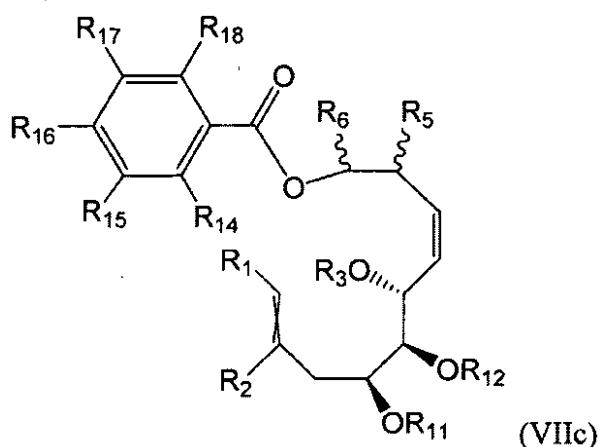


の化合物である、項目1～17のいずれか1項に記載の化合物。

(項目19)

式(VIIIc)：

## 【化117】



の化合物であって、式(VIIIc)において、

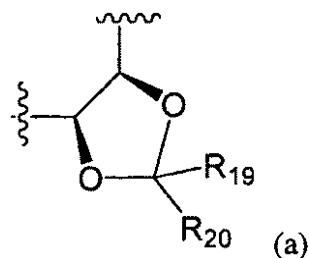
R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は各々独立して、水素およびC<sub>1～6</sub>アルキルからなる群より選択され；

R<sub>3</sub>は、ベンゾイルまたはベンジルから選択され、ここで該ベンゾイルまたはベンジルの各々は、0個、1個、2個もしくは3個の置換基で置換されており、該置換基は独立して、-OH、-O(C<sub>1～4</sub>アルキル)、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1～4</sub>アルキル)、-N(C<sub>1～4</sub>アルキル)<sub>2</sub>、アミド、-OCO(C<sub>1～4</sub>アルキル)および(C<sub>1～4</sub>アルキル)から選択され；

R<sub>5</sub>およびR<sub>6</sub>は各々独立して、水素、ハロゲン、C<sub>1～6</sub>アルキル、C<sub>1～6</sub>ハロアルキル、およびC<sub>1～6</sub>アルコキシからなる群より選択され；

R<sub>11</sub>およびR<sub>12</sub>は、各々独立して、水素および塩基安定性酸素保護基からなる群より選択されるか；またはR<sub>11</sub>およびR<sub>12</sub>は一緒になって、構造(a)：

## 【化118】



の 5 員ヘテロシクリルジイルを形成し；

構造 (a) において、 $R_{1,9}$  および  $R_{2,0}$  は各々独立して、水素、 $C_{1-6}$  アルキル、 $C_{1-6}$  ハロアルキルおよび  $C_{1-6}$  アルコキシからなる群より選択され；そして  $R_{1,4}$ 、 $R_{1,5}$ 、 $R_{1,6}$ 、 $R_{1,7}$ 、および  $R_{1,8}$  のうちの少なくとも 1 つは、 $NO_2$ 、 $-NH_3^+$ 、 $-COH$ 、 $-CO(C_{1-4}$  アルキル)、 $-COC_1$ 、 $-COOH$ 、 $-COO(C_{1-4}$  アルキル)、 $-N(R_3)_3^+$ 、 $-SO_3H$ 、ニトリル、 $-CF_3$  およびハロゲンからなる群より選択され、そして  $R_{1,4}$ 、 $R_{1,5}$ 、 $R_{1,6}$ 、 $R_{1,7}$ 、および  $R_{1,8}$  のうちの残りのものは、各々独立して H である。

化合物。

(項目 20)

$R_1$  および  $R_2$  が各々独立して、水素である、項目 19 に記載の化合物。

(項目 21)

$R_3$  が 4 - メトキシベンジルである、項目 19 ~ 20 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 22)

$R_5$  および  $R_6$  が各々独立して、水素またはメチルである、項目 19 ~ 21 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 23)

$R_{1,6}$  が  $NO_2$  であり、そして  $R_{1,4}$ 、 $R_{1,5}$ 、 $R_{1,7}$ 、および  $R_{1,8}$  の各々が独立して水素である、項目 19 ~ 22 のいずれか 1 項に記載の化合物。

### 【手続補正 3】

【補正対象書類名】図面

【補正対象項目名】図 1

【補正方法】変更

【補正の内容】

【図 1】

Figure 1

