

【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 0 7 D 313/00 (2006.01)

C 0 7 D 317/24 (2006.01)

C 0 7 D 317/22 (2006.01)

C 0 7 D 493/04 (2006.01)

C 0 7 D 407/06 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 313/00

C 0 7 D 317/24 C S P

C 0 7 D 317/22

C 0 7 D 493/04 1 1 1

C 0 7 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

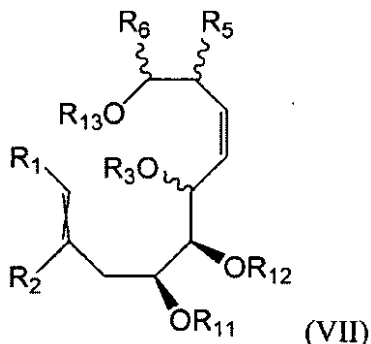
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (V I I) :

【化 1 1 1】



の化合物であって、式 (V I I) において、

R₁ および R₂ は各々独立して、水素、C₁ ~ 6 アルキル、C₃ ~ 6 非共役アルケニルおよび C₃ ~ 6 非共役アルキニルからなる群より選択され；

R₃ は、第一の芳香族環を含有する酸素保護基であり；

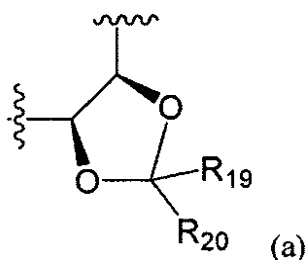
R₅ および R₆ は各々独立して、水素、ハロゲン、C₁ ~ 6 アルキル、C₂ ~ 6 アルケニル、C₂ ~ 6 アルキニル、C₁ ~ 6 ハロアルキル、C₁ ~ 6 アルコキシ、フェニルおよびベンジルからなる群より選択され、ここで該フェニルまたはベンジルは、ハロゲン、ヒドロキシル、C₁ ~ 3 アルキル、および NH₂ から独立して選択される 0 個、1 個、2 個、もしくは 3 個の置換基で置換されているか；あるいは

R_5 および R_6 は、これらが結合している炭素と一緒に、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、構造 (a)：

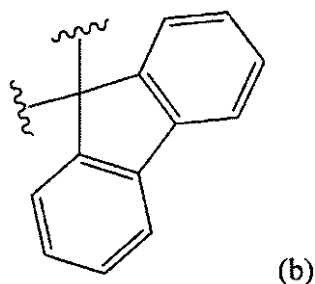
【化 1 1 2】



の5員ヘテロシクリルジールを形成し；

構造 (a) において、 R_{19} および R_{20} は各々独立して、水素、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_1 \sim 6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim 6$ 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、構造 (b)：

【化 1 1 3】



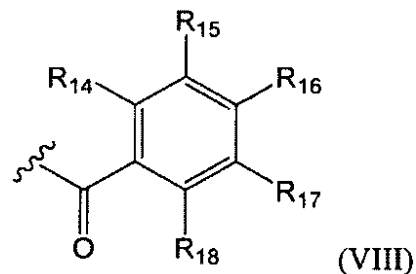
のフルオレニル部分を表し；そして

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 1 1 4】



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_2 、 $-NH_3^+$ 、 $-COH$ 、 $-CO(C_1 \sim 4 \text{ アルキル})$ 、 $-COCl$ 、 $-COOH$ 、 $-COO(C_1 \sim 4 \text{ アルキル})$ 、 $-NR_3^+$ 、 $-SO_3H$ 、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、 $-OH$ 、 $-O(C_1 \sim 4 \text{ アルキル})$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim 4 \text{ アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim 4 \text{ アルキル})_2$ 、アミド、 $-OCO(C_1 \sim 4 \text{ アルキル})$ および $(C_1 \sim 4 \text{ アルキル})$ 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_3 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_5 および R_6 が独立して、水素および $C_1 \sim 6$ 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_5 および R_6 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。

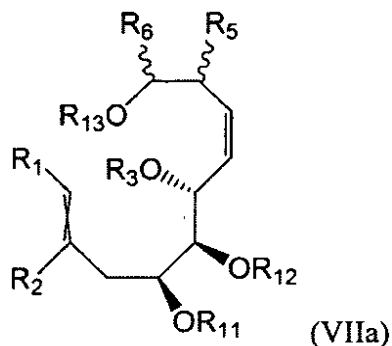
【請求項 9】

R_{14} 、 R_{15} 、 R_{16} 、 R_{17} 、および R_{18} のうちの少なくとも 1 つが、 NO_2 、 $-NH_3^+$ 、 $-COH$ 、 $-CO(C_1 \sim 4 \text{ アルキル})$ 、 $-COCl$ 、 $-COOH$ 、 $-COO(C_1 \sim 4 \text{ アルキル})$ 、 $-NR_3^+$ 、 $-SO_3H$ 、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_{14} 、 R_{15} 、 R_{16} 、 R_{17} 、および R_{18} 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】

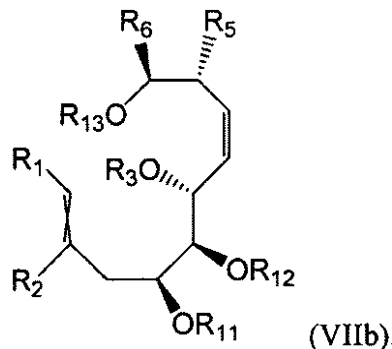


の化合物である、請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【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。

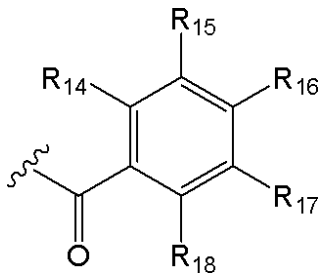
【請求項 12】

R_1 および R_2 が各々独立して水素であり、

R_3 が 4 - メトキシベンジルであり、

R_5 および R_6 が各々独立して、水素またはメチルであり、

R₁₃が、
【化1A】



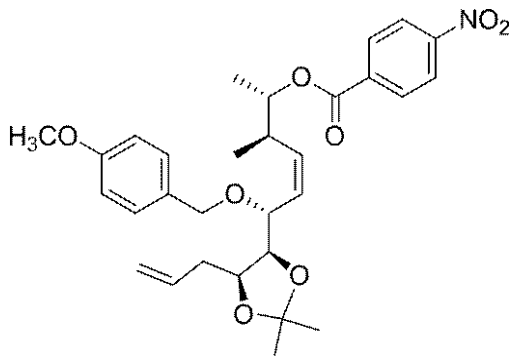
であり；

ここで、R₁₆はNO₂であり、R₁₄、R₁₅、R₁₇、およびR₁₈の各々が水素
である、請求項11に記載の化合物。

【請求項13】

以下の構造：

【化2A】



を有する、請求項12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】0029

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0029】

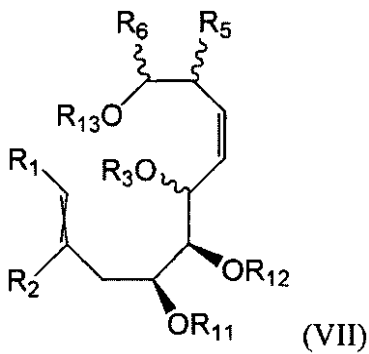
いくつかの実施形態において、R₁およびR₂は各々独立して、水素である。いくつかの実施形態において、R₃は4-メトキシベンジルである。いくつかの実施形態において、R₅およびR₆は各々独立して、水素またはメチルである。いくつかの実施形態において、R₁₆はNO₂であり、そしてR₁₄、R₁₅、R₁₇、およびR₁₈の各々は独立して、水素である。

本発明は、例えば以下の項目を提供する。

(項目1)

式(VII)：

【化 1 0 7】



の中間体であって、式 (V I I) において、

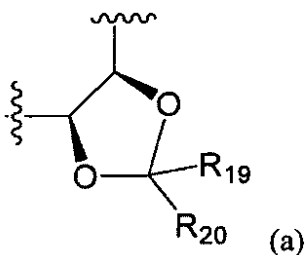
R₁ および R₂ は各々独立して、水素、C₁ ~ 6 アルキル、C₃ ~ 6 非共役アルケニルおよび C₃ ~ 6 非共役アルキニルからなる群より選択され；

R₃ 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；

R₅ および R₆ は各々独立して、水素、ハロゲン、C₁ ~ 6 アルキル、C₂ ~ 6 アルケニル、C₂ ~ 6 アルキニル、C₁ ~ 6 ハロアルキル、C₁ ~ 6 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、C₁ ~ 3 アルキル、および NH₂ 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 R₅ および R₆ は、これらが結合する炭素と一緒に、5 員 ~ 6 員の非共役炭素環式環を形成し；

R₁₁ および R₁₂ 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 R₁₁ および R₁₂ は一緒になって、構造 (a) ；

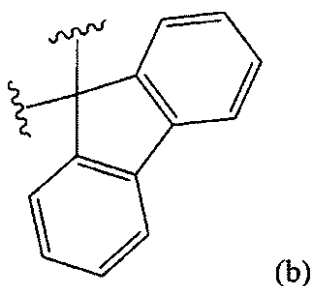
【化 1 0 8】



の 5 員ヘテロシクリルジイルを形成し；

構造 (a) において、R₁₉ および R₂₀ は各々独立して、水素、C₁ ~ 6 アルキル、C₁ ~ 6 ハロアルキル、C₁ ~ 6 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 R₁₉ および R₂₀ は一緒になって、構造 (b) ；

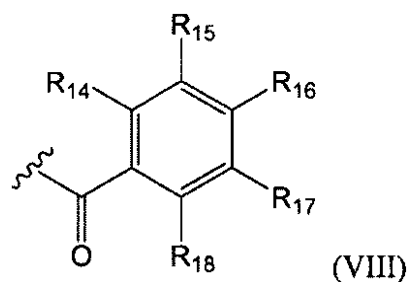
【化 1 0 9】



のフルオレニル部分を表し；そして

R₁₃ は、

【化 1 1 0】



であり；そして

R_{14} 、 R_{15} 、 R_{16} 、 R_{17} 、および R_{18} は各々独立して、 H 、 NO_2 、 $-NH_3^+$ 、 $-COH$ 、 $-CO(C_{1\sim4} \text{ アルキル})$ 、 $-COCl$ 、 $-COOH$ 、 $-COO(C_{1\sim4} \text{ アルキル})$ 、 $-NR_3^+$ 、 $-SO_3H$ 、ニトリル、 $-CF_3$ およびハロゲンからなる群より選択される、

中間体。

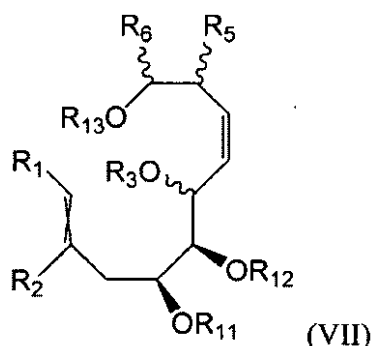
(項目 2)

R_3 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 1 1 1】



の中間体であって、式 (VII) において、

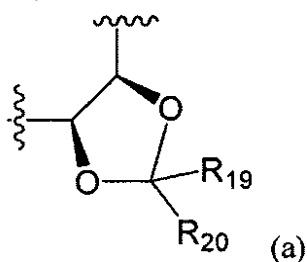
R_1 および R_2 は各々独立して、水素、 $C_{1\sim6}$ アルキル、 $C_{3\sim6}$ 非共役アルケニルおよび $C_{3\sim6}$ 非共役アルキニルからなる群より選択され；

R_3 は、第一の芳香族環を含有する酸素保護基であり；

R_5 および R_6 は各々独立して、水素、ハロゲン、 $C_{1\sim6}$ アルキル、 $C_{2\sim6}$ アルケニル、 $C_{2\sim6}$ アルキニル、 $C_{1\sim6}$ ハロアルキル、 $C_{1\sim6}$ 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、 $C_{1\sim3}$ アルキル、および NH_2 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あって、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} は一緒にあって、構造 (a)：

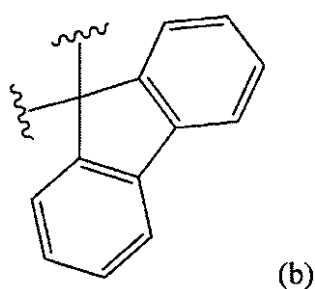
【化 1 1 2】



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、 $C_{1 \sim 6}$ アルキル、 $C_{1 \sim 6}$ ハロアルキル、 $C_{1 \sim 6}$ 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} は一緒になって、構造 (b) ；

【化 1 1 3】



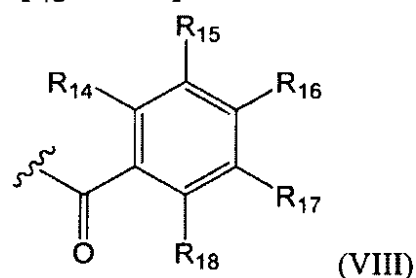
のフルオレニル部分を表し；そして

R_{13} は、第二の芳香族環を含有する酸素保護基である、
中間体。

(項目 4)

R_{13} が、

【化 1 1 4】



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_2 、 $-NH_3^+$ 、 $-COH$ 、 $-CO(C_{1 \sim 4} \text{ アルキル})$ 、 $-COCl$ 、 $-COOH$ 、 $-COO(C_{1 \sim 4} \text{ アルキル})$ 、 $-NR_3^+$ 、 $-SO_3H$ 、ニトリル、 $-CF_3$ およびハロゲンからなる群より選択される、

項目 3 に記載の化合物。

(項目 5)

R_1 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_2 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_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、 $-OH$ 、 $-O(C_{1-4} \text{アルキル})$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-4} \text{アルキル})$ 、 $-N(C_{1-4} \text{アルキル})_2$ 、アミド、 $-OCO(C_{1-4} \text{アルキル})$ および $(C_{1-4} \text{アルキル})$ 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_3 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_5 が水素および C_{1-6} 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_6 が水素および C_{1-6} 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_5 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_6 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_{14} 、 R_{15} 、 R_{16} 、 R_{17} 、および R_{18} のうちの1つは、 NO_2 、 $-NH_3^+$ 、 $-COH$ 、 $-CO(C_{1-4} \text{アルキル})$ 、 $-COCl$ 、 $-COOH$ 、 $-COO(C_{1-4} \text{アルキル})$ 、 $-NR_3^+$ 、 $-SO_3H$ 、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_{14} 、 R_{15} 、 R_{16} 、 R_{17} 、および R_{18} 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_{14} 、 R_{15} 、 R_{16} 、 R_{17} 、および R_{18} のうちの少なくとも1つが、 NO_2 、 $-NH_3^+$ 、 $-COH$ 、 $-CO(C_{1-4} \text{アルキル})$ 、 $-COCl$ 、 $-COOH$ 、 $-COO(C_{1-4} \text{アルキル})$ 、 $-NR_3^+$ 、 $-SO_3H$ 、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_{14} 、 R_{15} 、 R_{16} 、 R_{17} 、および R_{18} 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。

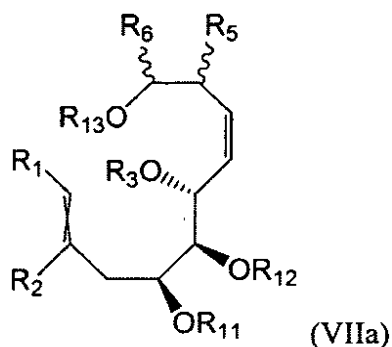
(項目16)

R_{16} が NO_2 であり、そして R_{14} 、 R_{15} 、 R_{17} 、および R_{18} 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】

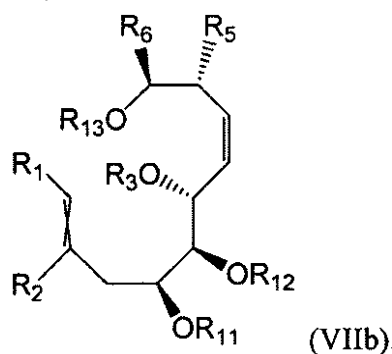


の化合物である、項目1～16のいずれか1項に記載の化合物。

(項目18)

前記式(VII)の化合物が(VIIb)：

【化 1 1 6】

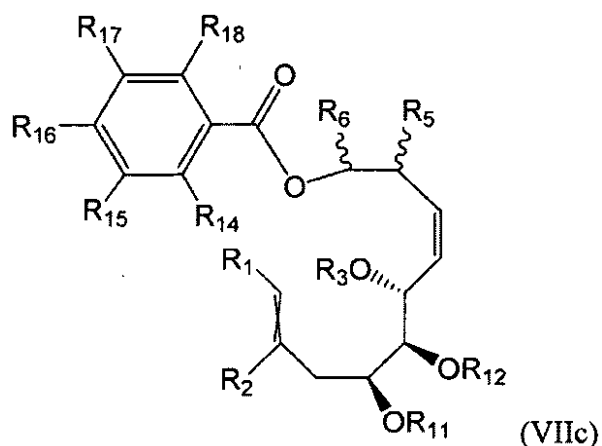


の化合物である、項目 1 ~ 1 7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 1 9)

式 (V I I c) :

【化 1 1 7】



の化合物であって、式 (V I I c) において、

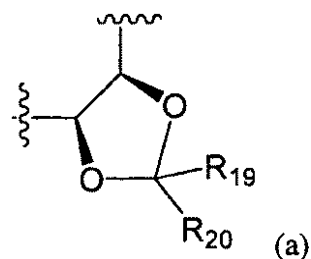
R_1 および R_2 は各々独立して、水素および C_{1-6} アルキルからなる群より選択され

R_3 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、 $-OH$ 、 $-O(C_{1-4} \text{ アルキル})$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_{1-4} \text{ アルキル})$ 、 $-N(C_{1-4} \text{ アルキル})_2$ 、アミド、 $-OCO(C_{1-4} \text{ アルキル})$ および $(C_{1-4} \text{ アルキル})$ から選択され；

R_5 および R_6 は各々独立して、水素、ハロゲン、 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；

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} は一緒になって、構造 (a) :

【化 1 1 8】



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、 $C_{1 \sim 6}$ アルキル、 $C_{1 \sim 6}$ ハロアルキルおよび $C_{1 \sim 6}$ アルコキシからなる群より選択され；そして

R_{14} 、 R_{15} 、 R_{16} 、 R_{17} 、および R_{18} のうちの少なくとも 1 つは、 NO_2 、 $-NH_3^+$ 、 $-COH$ 、 $-CO(C_{1 \sim 4}$ アルキル)、 $-COCl$ 、 $-COOH$ 、 $-COO(C_{1 \sim 4}$ アルキル)、 $-NR_3^+$ 、 $-SO_3H$ 、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_{14} 、 R_{15} 、 R_{16} 、 R_{17} 、および R_{18} 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 2 0)

R_1 および R_2 が各々独立して、水素である、項目 1 9 に記載の化合物。

(項目 2 1)

R_3 が 4 - メトキシベンジルである、項目 1 9 ~ 2 0 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 2 2)

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 1 9 ~ 2 1 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 2 3)

R_{16} が NO_2 であり、そして R_{14} 、 R_{15} 、 R_{17} 、および R_{18} の各々が独立して水素である、項目 1 9 ~ 2 2 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 】

Figure 1

