

【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8月3日(2006.8.3)

【公表番号】特表2005-529954(P2005-529954A)

【公表日】平成17年10月6日(2005.10.6)

【年通号数】公開・登録公報2005-039

【出願番号】特願2004-513249(P2004-513249)

【国際特許分類】

C 0 7 D 231/56 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 15/00 (2006.01)

A 6 1 P 17/02 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

C 0 7 D 403/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 231/56 A

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 15/00

A 6 1 P 17/02

A 6 1 P 27/02

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 35/00

C 0 7 D 403/12

A 6 1 K 31/506

【手続補正書】

【提出日】平成18年6月15日(2006.6.15)

【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

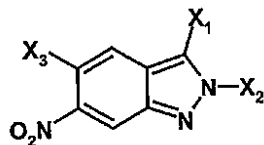
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

下記式(R)の化合物：

【化1】

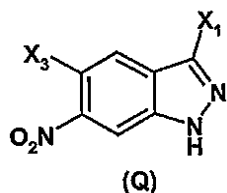


(R)

の製造方法であって、

下記式(Q)の化合物：

【化 2】



をアルキル化剤と反応させる段階を有する前記方法。

[上記式中、

X_1 は水素、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルまたは $C_1 \sim C_4$ ヒドロキシアルキルであり；

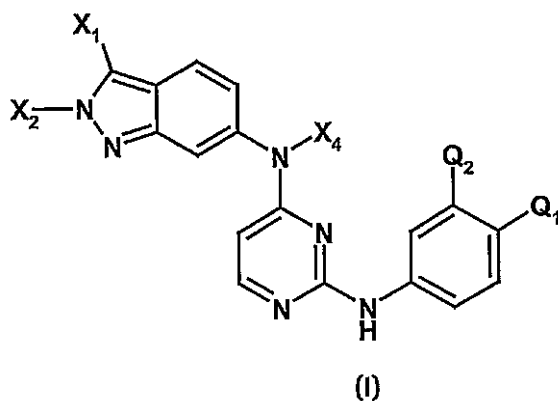
X_2 は $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルまたはアラルキルであり；

X_3 は水素またはハロゲンである。]

【請求項 2】

下記式 (I) の化合物：

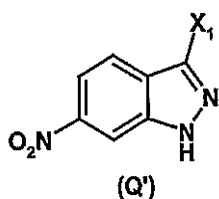
【化 3】



の製造方法であって、

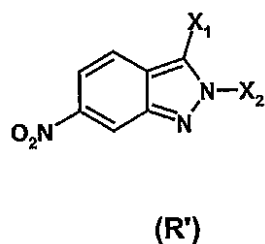
下記式 (Q) の化合物：

【化 4】



をアルキル化剤と反応させて下記式 (R) の化合物：

【化 5】



を得る段階を有する前記方法。

[上記式中、

X_1 は水素または $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

X_2 は $C_1 \sim C_4$ アルキルまたはベンジルであり；

X_4 は水素または $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

Q_1 は A^1 または A^2 であり ;

Q_1 が A^2 である場合は Q_2 は A^1 であり、 Q_1 が A^1 である場合は Q_2 は A^2 であり ;

A^1 は水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシであり ;

A^2 は $-(Z)_m-(Z^1)-(Z^2)$ によって定義される基であり ;

Z は $C(R)(R)$ であり、 R および R は独立に $-H$ もしくは $C_1 \sim C_4$ アルキルから選択されるか、あるいは R および R がそれらの結合している炭素と一体となって $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル基を形成しており、 m は 0、1、2 または 3 であり ;

Z^1 は $S(O)_2$ 、 $S(O)$ または $C(O)$ であり ;

Z^2 は $C_1 \sim C_4$ アルキル、 NR^1R^2 、アリール、アリールアミノ、アラルキル、アラルコキシまたはヘテロアリールであり ;

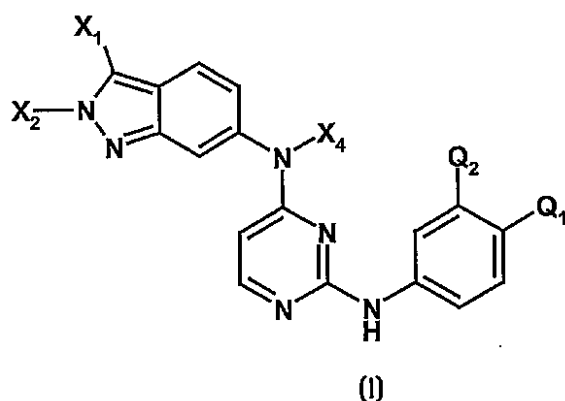
R^1 および R^2 はそれぞれ独立に、水素、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $-S(O)_2$ R^3 および $-C(O)R^3$ から選択され ;

R^3 は $C_1 \sim C_4$ アルキルまたは $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルである。]

【請求項 3】

下記式 (I) の化合物 :

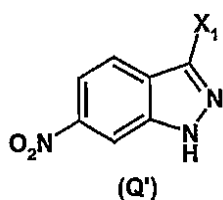
【化 6】



の製造方法であって、

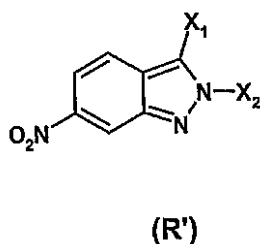
(i) 下記式 (Q') の化合物 :

【化 7】



をアルキル化剤と反応させて下記式 (R') の化合物 :

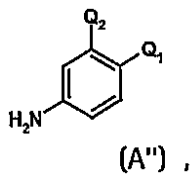
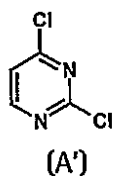
【化 8】



を得る段階 ; ならびに

(ii) 前記式 (R') の化合物を前記式 (I) の化合物に変換する段階であって、その変換段階が下記式 (A') の化合物およびその後の下記式 (A') の化合物 :

【化 9】



との連続的な縮合を含む段階を有する前記方法。

[上記式中、

X_1 は水素または $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

X_2 は $C_1 \sim C_4$ アルキルまたはベンジルであり；

X_4 は水素または $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

Q_1 は A^1 または A^2 であり；

Q_1 が A^2 である場合は Q_2 は A^1 であり、 Q_1 が A^1 である場合は Q_2 は A^2 であり；

A^1 は水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシであり；

A^2 は $-(Z)_m-(Z^1)-(Z^2)$ によって定義される基であり；

Z は $C(R)(R)$ であり、 R および R は独立に $-H$ または $C_1 \sim C_4$ アルキルから選択されるか、あるいは R および R がそれらの結合している炭素と一体となって $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル基を形成しており、 m は 0、1、2 または 3 であり；

Z^1 は $S(O)_2$ 、 $S(O)$ または $C(O)$ であり；

Z^2 は $C_1 \sim C_4$ アルキル、 NR^1R^2 、アリール、アリールアミノ、アラルキル、アラルコキシまたはヘテロアリールであり；

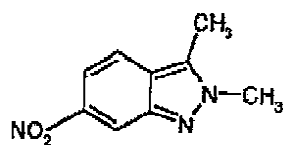
R^1 および R^2 はそれぞれ独立に、水素、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $-S(O)_2$ R^3 および $-C(O)R^3$ から選択され；

R^3 は $C_1 \sim C_4$ アルキルまたは $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルである。]

【請求項 4】

下記式の化合物：

【化 10】

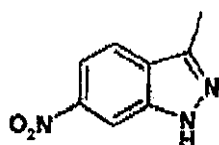


(2,3-ジメチル-6-ニトロ-2H-インダゾール)

の製造方法であって、

下記式の化合物：

【化 11】

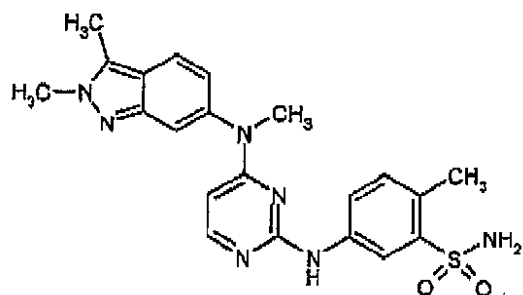


をアルキル化剤と反応させる段階を有する前記方法。

【請求項 5】

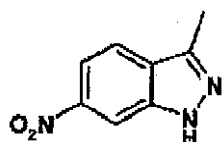
下記式の化合物：

【化 1 2】



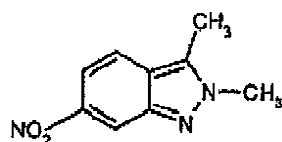
の製造方法であって、
下記式の化合物：

【化 1 3】



をアルキル化剤と反応させて、下記式の化合物：

【化 1 4】

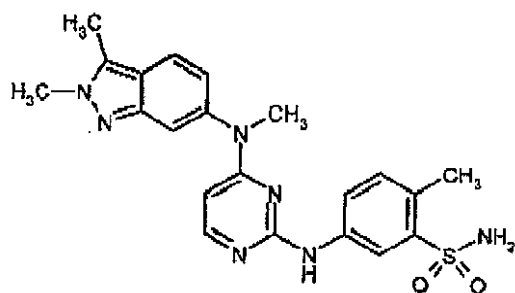


(2,3-ジメチル-6-ニトロ-2H-インダゾール)
を得る段階を有する前記方法。

【請求項 6】

下記式の化合物：

【化 1 5】

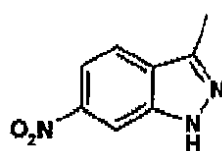


(5-({4-[(2,3-ジメチル-2H-インダゾール-6-イル)(メチル)アミノ]ピリミジン-2-イル}アミノ)-2-メチルベンゼンスルホンアミド)

の製造方法であって、

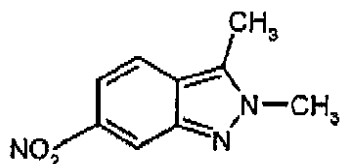
(i) 下記式の化合物：

【化 1 6】



をアルキル化剤と反応させて下記式の化合物：

【化 17】

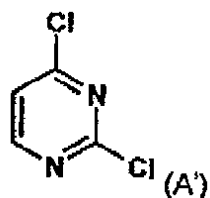


(2,3-ジメチル-6-ニトロ-2H-インダゾール)

を得る段階；ならびに

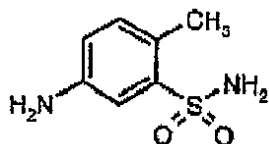
(ii) 前記化合物 2,3-ジメチル-6-ニトロ-2H-インダゾールを、化合物 5-({4-[(2,3-ジメチル-2H-インダゾール-6-イル)(メチル)アミノ]ピリミジン-2-イル}アミノ)-2-メチルベンゼンスルホンアミドに変換する段階であって、その変換段階が下記式 (A) の化合物：

【化 18】



との、およびその後の下記式の化合物：

【化 19】



(5-アミノ-2-メチルベンゼンスルホンアミド)

との、連続的な縮合を含む段階を有する前記方法。

【請求項 7】

方法が、下記式の化合物の一塩酸塩を得るためである、請求項 5 または 6 に記載の方法。

【化 20】

