

【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1月5日(2006.1.5)

【公表番号】特表2005-504770(P2005-504770A)

【公表日】平成17年2月17日(2005.2.17)

【年通号数】公開・登録公報2005-007

【出願番号】特願2003-521232(P2003-521232)

【国際特許分類】

C 07 D 471/04 (2006.01)

C 07 B 61/00 (2006.01)

【F I】

C 07 D 471/04 1 1 3

C 07 B 61/00 3 0 0

【手続補正書】

【提出日】平成17年8月1日(2005.8.1)

【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

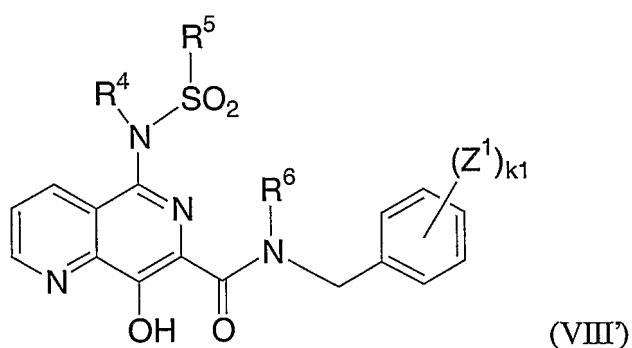
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

下記式(VIII)の化合物：

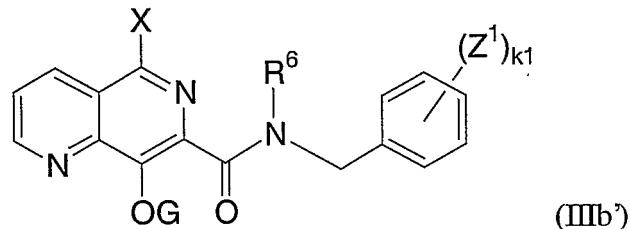
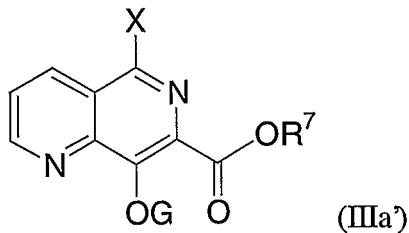
【化1】



の製造方法であって、

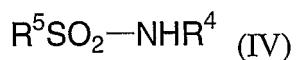
(C) 下記式(I I I a)または(I I I b)の化合物：

【化2】



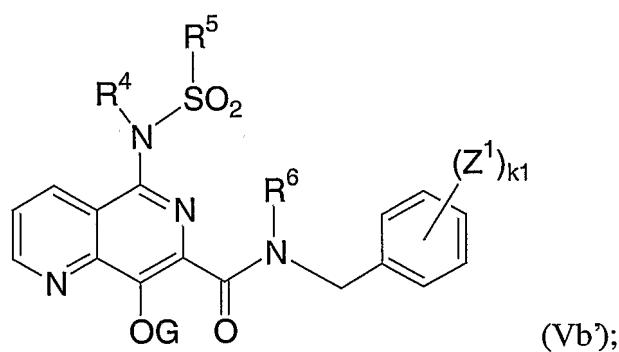
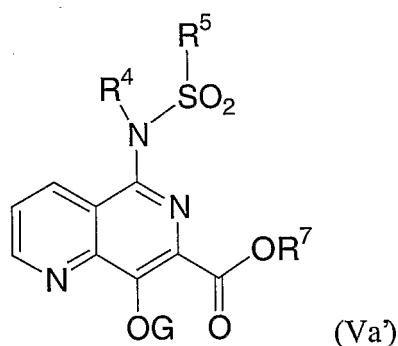
を、溶媒中ならびに銅系促進剤および銅系キレート剤の存在下に下記式(IV)のスルホンアミド：

【化3】



と反応させて、下記式(Va)または(Vb)の化合物：

【化4】

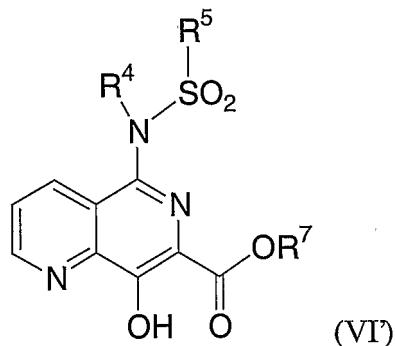


を得る段階；

(D)段階Cから得られる化合物が化合物Vaである場合に、

(D1)化合物Vaをフェノール脱保護剤と反応させて、下記式(VI)の化合物：

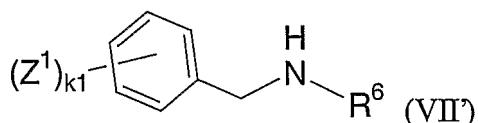
【化5】



を得る段階、および

(D2) カップリング化合物V I を下記式(VII)のアミン：

【化6】



とカップリングさせて、化合物V I I I を得る段階；ならびに

(E)段階Cから得られる化合物が化合物V b である場合に、化合物V b をフェノール脱保護剤と反応させて化合物V I I I を得る段階

を含み；

各Z¹が独立に、

(1) - H、

(2) それぞれが独立にハロゲン、-O-C₁-₆アルキル、-O-C₁-₆ハロアルキル、-OH、-CN、-NO₂、-C(=O)R^a、-CO₂R^a、-SR^a、-N(R^b)₂もしくは-C(=O)N(R^a)₂である1から7個の置換基で置換されていても良い-C₁-₆アルキル、

(3) それぞれが独立にハロゲン、-O-C₁-₆アルキル、-OHもしくは-SR^aである1から7個の置換基で置換されていても良い-O-C₁-₆アルキル、

(4) -OH、

(5) ハロゲン、

(6) -NO₂、

(7) -CN、

(8) -C(=O)R^a、

(9) -CO₂R^a、

(10) -SR^a、

(11) -N(R^b)₂、

(12) -C(=O)N(R^a)₂、

(13) -SO₂R^a、

(14) -N(R^a)SO₂R^aおよび

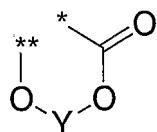
(15) -C₂-₅アルケニル

からなる群から選択され；

k1が、0、1、2、3、4または5に等しい整数であり；

Gが、フェノール保護基であるか；あるいは段階Cにおける反応物が化合物II I aである場合には、GおよびR⁷がそれらが結合しているフェノール性酸素部分およびカルボニルオキシ部分と一体となって、下記式のフェノール保護環状基：

【化7】



を形成しており；

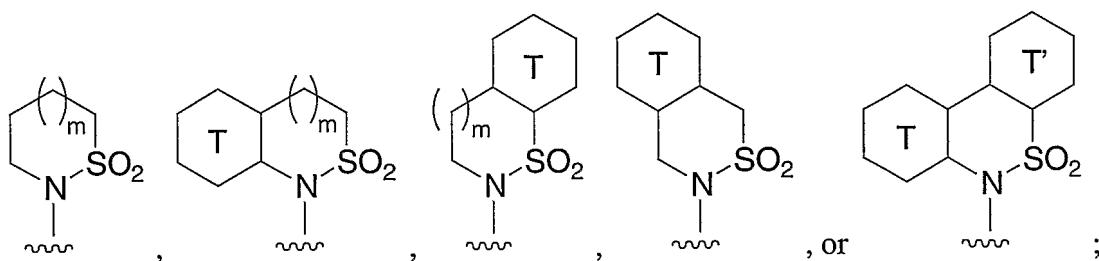
上記式において、*および**はそれぞれ、ナフチリジン環における環炭素7および8に対する縮合個所を示し；Yは-C(R^c)(R^d)または-B(R^e)であり；

Xがハロであり；

R⁴が、-H、-C₁₋₆アルキルまたはアリールであり；前記アルキルは、それぞれが独立にハロゲン、-O-C₁₋₆アルキル、-O-C₁₋₆ハロアルキル、-OH、-CN、-NO₂、-C(=O)R^a、-CO₂R^a、-SR^a、-N(R^b)₂または-C(=O)N(R^a)₂である1から7個の置換基で置換されていても良く；前記アリールは、それぞれが独立にハロゲン、-C₁₋₆アルキル、-C₁₋₆ハロアルキル、-O-C₁₋₆アルキル、-O-C₁₋₆ハロアルキル、-OH、-CN、-NO₂、-C(=O)R^a、-CO₂R^a、-SR^a、-N(R^b)₂または-C(=O)N(R^a)₂である1から7個の置換基で置換されていても良く；

R⁵が、C₁₋₆アルキルまたはアリールであり；前記アルキルは、それぞれが独立にハロゲン、-O-C₁₋₆アルキル、-O-C₁₋₆ハロアルキル、-OH、-CN、-NO₂、-C(=O)R^a、-CO₂R^a、-SR^a、-N(R^b)₂または-C(=O)N(R^a)₂である1から7個の置換基で置換されていても良く；前記アリールは、それぞれが独立にハロゲン、-C₁₋₆アルキル、-C₁₋₆ハロアルキル、-O-C₁₋₆アルキル、-O-C₁₋₆ハロアルキル、-OH、-CN、-NO₂、-C(=O)R^a、-CO₂R^a、-SR^a、-N(R^b)₂または-C(=O)N(R^a)₂である1から7個の置換基で置換されていても良く；あるいは別の形態として、R⁴とR⁵がそれらが結合している-NSO₂-部分と一体となって、下記式のスルタム基：

【化8】



を形成しており；上記式において、TおよびT'はそれぞれ独立に、飽和または芳香族の6員炭素環であり；mが0、1または2に等しい整数であり；前記スルタム基は、それぞれが独立にハロゲン、-C₁₋₆アルキル、-C₁₋₆ハロアルキル、-O-C₁₋₆アルキル、-O-C₁₋₆ハロアルキル、-OH、-CN、-NO₂、-C(=O)R^a、-CO₂R^a、-SR^a、-N(R^b)₂または-C(=O)N(R^a)₂である1から4個の置換基で置換されていても良く；

R⁶が、-Hまたは-C₁₋₆アルキルであり；前記アルキルは、ハロゲン、-O-C₁₋₆アルキル、-O-C₁₋₆ハロアルキル、-N(R^b)₂および-CO₂R^aから独立に選択される1から7個の置換基で置換されていても良く；

R⁷が、-H、-C₁₋₆アルキルまたはアリールであり；前記アルキルは、それぞれが独立にハロゲン、-O-C₁₋₆アルキル、-O-C₁₋₆ハロアルキル、-OH、-CN、-NO₂、-C(=O)R^a、-CO₂R^a、-SR^a、-N(R^b)₂、-C(=O)N(R^a)₂またはフェニルである1から7個の置換基で置換されていても良く；

前記アリールは、それが独立にハロゲン、-C₁-₆アルキル、-C₁-₆ハロアルキル、-O-C₁-₆アルキル、-O-C₁-₆ハロアルキル、-OH、-CN、-NO₂、-C(=O)R^a、-CO₂R^a、-SR^a、-N(R^b)₂または-C(=O)N(R^a)₂である1から7個の置換基で置換されていても良く；

各R^aが独立に、-Hまたは-C₁-₆アルキルであり；

各R^bが独立に、-C₁-₆アルキルであり；

R^cおよびR^dがそれぞれ独立に、-Hまたはそれが独立にハロゲン、-O-C₁-₆アルキルまたは-O-C₁-₆ハロアルキルである1から7個の置換基で置換されていても良い-C₁-₆アルキルであり；

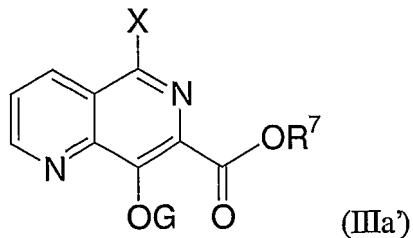
R^eが、-C₁-₆アルキル、-O-C₁-₆アルキル、アリールまたは-O-アリールであり；前記アルキルは、それが独立にハロゲン、-O-C₁-₆アルキルまたは-O-C₁-₆ハロアルキルである1から7個の置換基で置換されていても良く；前記アリールは、それが独立にハロゲン、-C₁-₆アルキル、-C₁-₆ハロアルキル、-O-C₁-₆アルキル、-O-C₁-₆ハロアルキル、-OH、-CN、-NO₂、-CHO、-C(=O)-C₁-₆アルキル、-CO₂H、-CO₂-C₁-₆アルキル、-SH、-S-C₁-₆アルキル、-N(-C₁-₆アルキル)₂、-C(=O)NH₂または-C(=O)N(-C₁-₆アルキル)₂である1から7個の置換基で置換されていても良く；

各アリールが独立に、フェニル、ナフチル、アントリルまたはフェナントリルである、前記方法。

【請求項2】

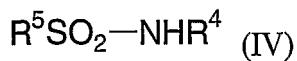
(C)下記式(IIa)の化合物：

【化9】



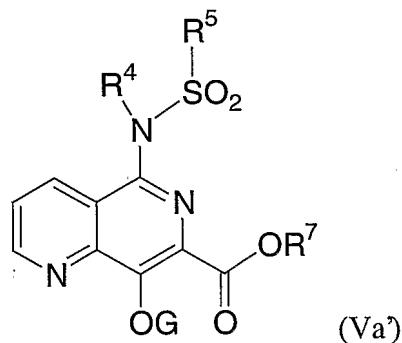
を、溶媒中ならびに銅系促進剤および銅系キレート剤の存在下に下記式(IV)のスルホンアミド：

【化10】



と反応させて、下記式(Va)の化合物：

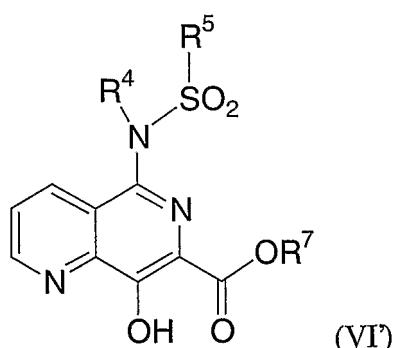
【化11】



を得る段階；

(D1) 化合物Va をフェノール脱保護剤で処理して、下記式(VI)の化合物：

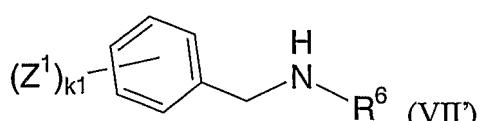
【化12】



を得る段階；および

(D2) 化合物VI を下記式(VII)のアミン：

【化13】



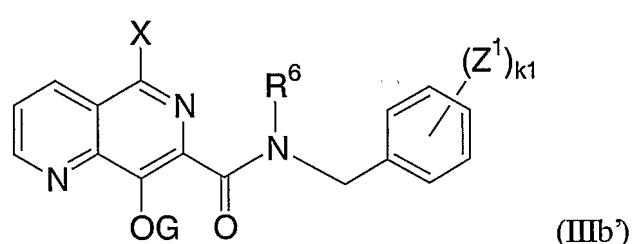
とカップリングさせて、化合物VIIIを得る段階

を含む化合物VIIIの製造方法である請求項1に記載の方法。

【請求項3】

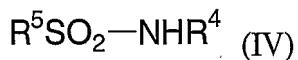
(C) 下記式(IIIB)の化合物：

【化14】



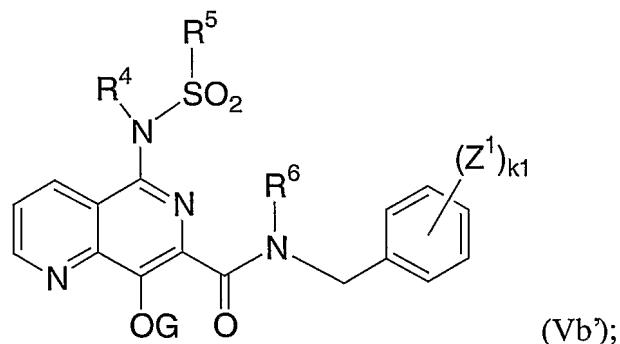
を、溶媒中ならびに銅系促進剤および銅系キレート剤の存在下に下記式(IV)のスルホンアミド：

【化15】



と反応させて、下記式(Vb)の化合物：

【化16】



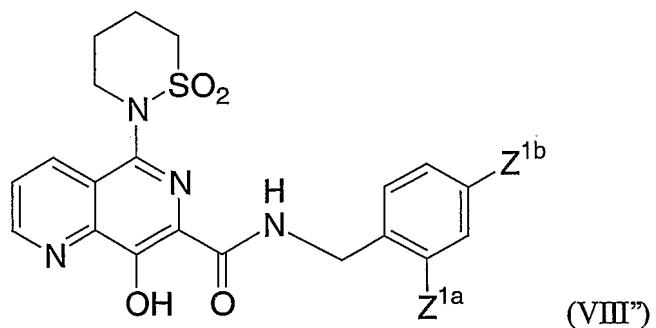
を得る段階；

(E) 化合物Vb をフェノール脱保護剤と反応させて化合物VIII を得る段階を含む化合物VIII の製造方法である請求項1に記載の方法。

【請求項4】

下記式(VIII)の化合物：

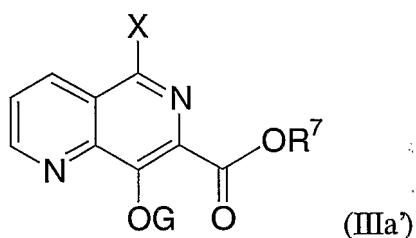
【化17】



の製造方法であって、

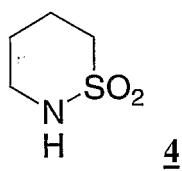
(C) 下記式(IIa)の化合物：

【化18】



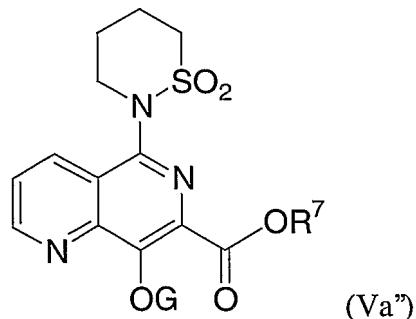
を、溶媒中ならびに銅系促進剤および銅系キレート剤の存在下にスルタム4：

【化19】



と反応させて下記式(Va")の化合物：

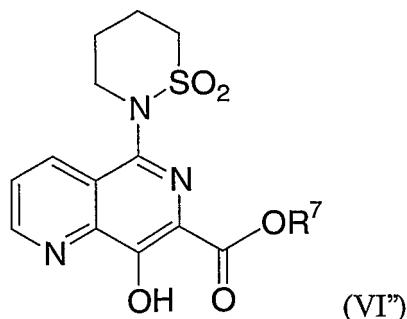
【化20】



を得る段階；

(D1) 化合物Va をフェノール脱保護剤で処理して、下記式(VI")の化合物：

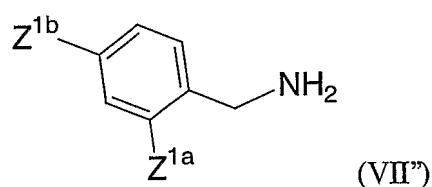
【化21】



を得る段階；および

(D2) 化合物VI"を下記式(VII")のアミン：

【化22】



とカップリングさせて、化合物VIII"を得る段階を含み；

Gがフェノール保護基であり；

Xがハロであり；

Z^{1a}およびZ^{1b}がそれぞれ独立に、-Hまたはハロであり；R⁷が-C₁₋₆アルキル、フェニルまたはベンジルである、前記方法。

【請求項5】

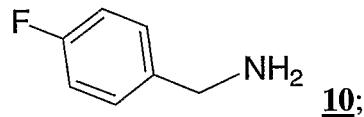
化合物VaまたはVb上の前記-OG基がエーテル、シリルエーテル、カルボン酸エス

テルまたはスルホン酸エステルである請求項4に記載の方法。

【請求項 6】

段階 D 2 でのアミン V I I が化合物10：

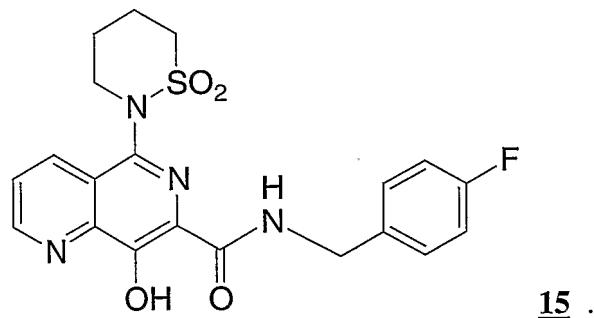
【化 2 3】



であり；

化合物 V I I I が化合物15：

【化 2 4】

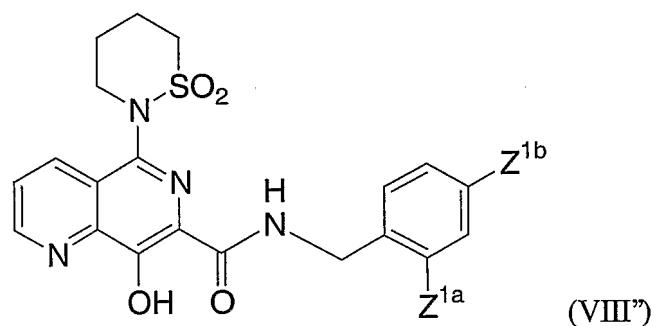


である請求項4に記載の方法。

【請求項 7】

下記式 (V I I I) の化合物：

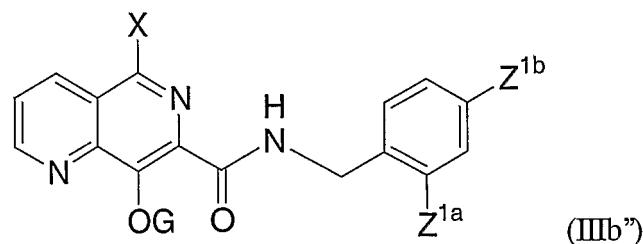
【化 2 5】



の製造方法であって、

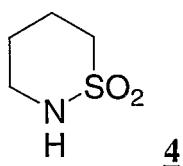
(C) 下記式 (I I I b) の化合物：

【化 2 6】



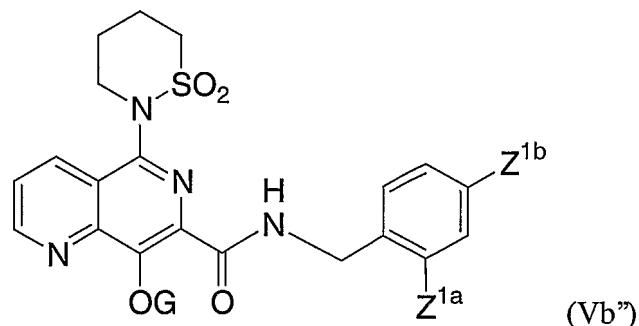
を、溶媒中ならびに銅系促進剤および銅系キレート剤の存在下にスルタム4：

【化27】



と反応させて下記式 (Vb') の化合物 :

【化28】



を得る段階；および

(E) 化合物 Vb' をフェノール脱保護剤と反応させて化合物 V III' を得る段階を含み；

G がフェノール保護基であり；

X がハロであり；

Z^{1a} および Z^{1b} がそれぞれ独立に -H またはハロである、前記方法。

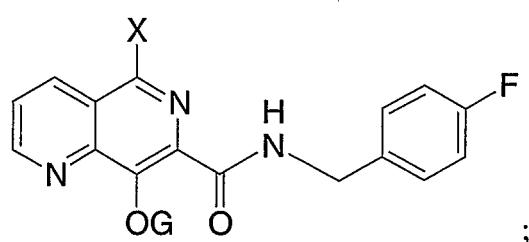
【請求項8】

化合物 V a または V b 上の前記 -OG 基がエーテル、シリルエーテル、カルボン酸エステルまたはスルホン酸エステルである請求項 7 に記載の方法。

【請求項9】

段階 C での化合物 I II b' が：

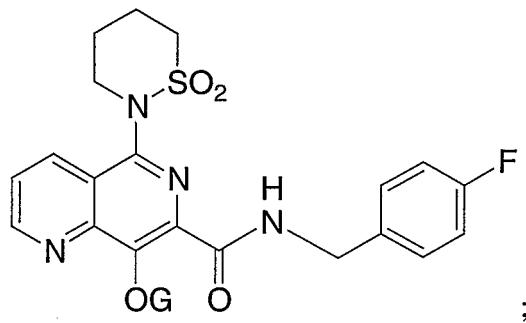
【化29】



であり；

段階 E での化合物 Vb' が：

【化30】

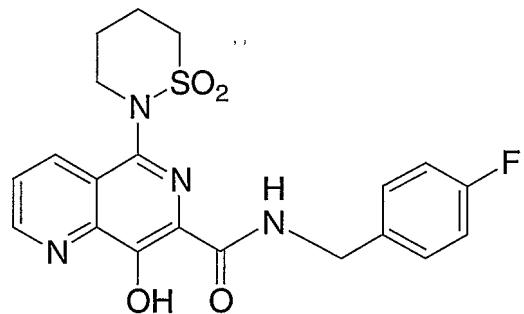


;

であり；

化合物VIIIが化合物15：

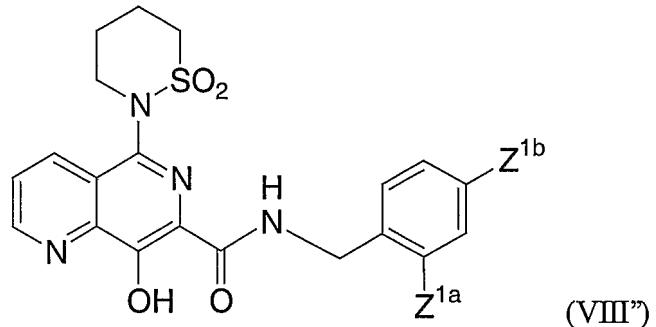
【化31】

15 .である請求項7に記載の方法。

【請求項10】

下記式(VIII)の化合物：

【化32】

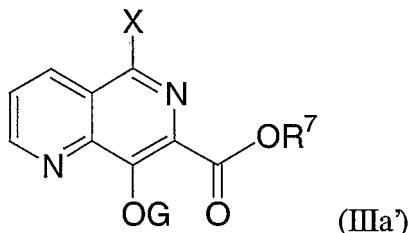


(VIII'')

の製造方法であって、

(C)下記式(IIIa)の化合物：

【化33】

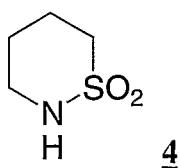


(IIIa)

を、溶媒中ならびに触媒量の銅(I)化合物、塩基および場合によりリガンドの存在下に

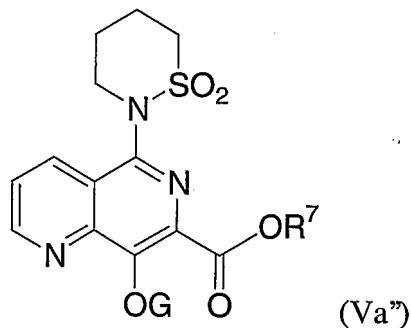
スルタム 4 :

【化 3 4】



と反応させて、下記式 (Va") の化合物 :

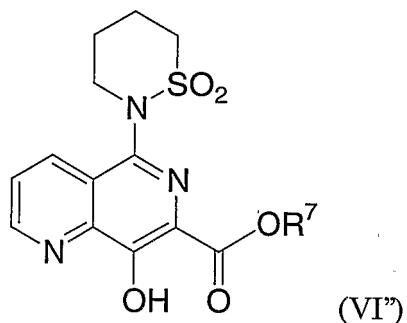
【化 3 5】



を得る段階 :

(D 1) 化合物 Va をフェノール保護剤で処理して、下記式 (VI") の化合物 :

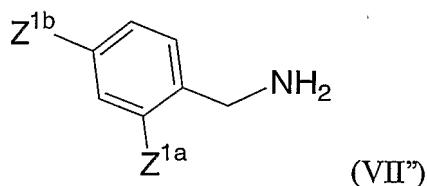
【化 3 6】



を得る段階 ; ならびに

(D 2) 化合物 VI" を下記式 (VII") の化合物 :

【化 3 7】



とカップリングさせて化合物 VII" を得る段階を含み ;

G がフェノール保護基であり ; X がハロであり ; Z^{1a} および Z^{1b} がそれぞれ独立に -H またはハロであり ; R⁷ が -C₁ -₆ アルキル、フェニルまたはベンジルである、前記方法。