

【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 0 7 D 471/04 (2006.01)

C 0 7 B 61/00 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 471/04 1 1 3

C 0 7 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

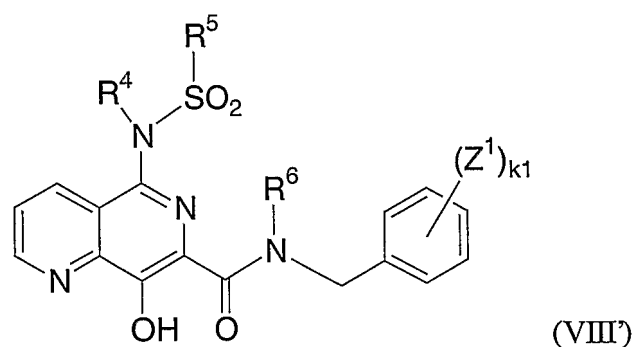
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

下記式 (V I I I) の化合物：

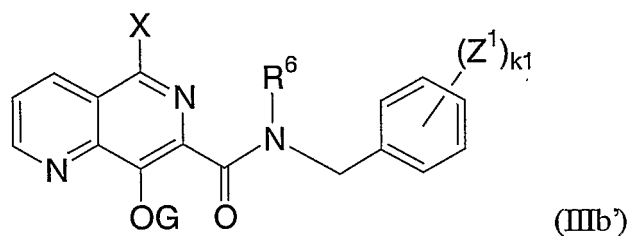
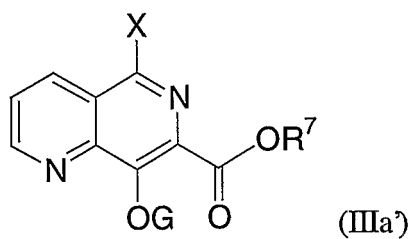
【化 1】



の製造方法であって、

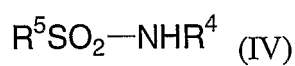
(C) 下記式 (I I I a) または (I I I b) の化合物：

【化 2】



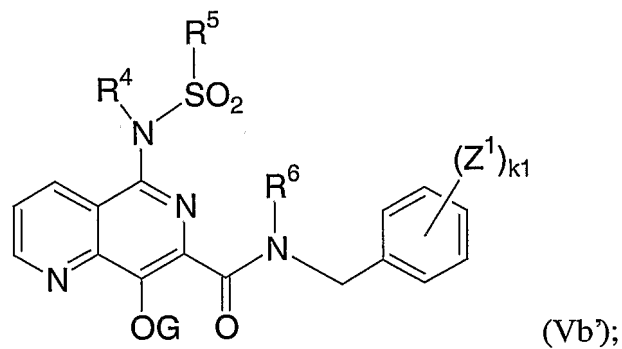
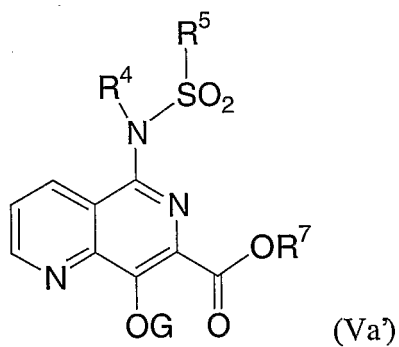
を、溶媒中ならびに銅系促進剤および銅系キレート剤の存在下に下記式 (IV) のスルホンアミド：

【化 3】



と反応させて、下記式 (Va) または (Vb) の化合物：

【化 4】

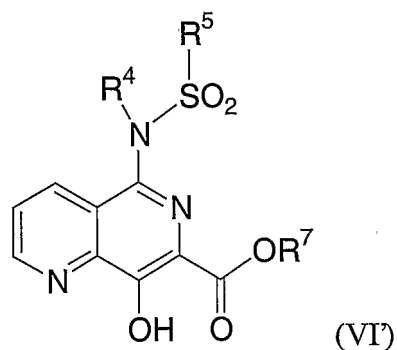


を得る段階；

(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：

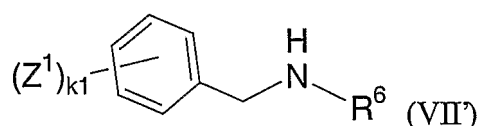
【化 5】



を得る段階、および

(D2) カップリング化合物 V I を下記式 (V I I) 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 Z^1 が独立に、

(1) - H、

(2) それぞれが独立にハロゲン、- O - C_{1-6} アルキル、- O - C_{1-6} ハロアルキル、- OH、- CN、- NO₂、- C(=O) R^a、- CO₂ R^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 - C_{1-6} アルキル、

(3) それぞれが独立にハロゲン、- O - C_{1-6} 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 - C_{1-6} アルキル、

(4) - OH、

(5) ハロゲン、

(6) - NO₂、

(7) - CN、

(8) - C(=O) R^a、

(9) - CO₂ R^a、

(10) - SR^a、

(11) - N(R^b)₂、

(12) - C(=O) N(R^a)₂、

(13) - SO₂ R^a、

(14) - N(R^a) SO₂ R^a および

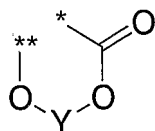
(15) - C_{2-5} アルケニル

からなる群から選択され；

k_1 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 I I 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；

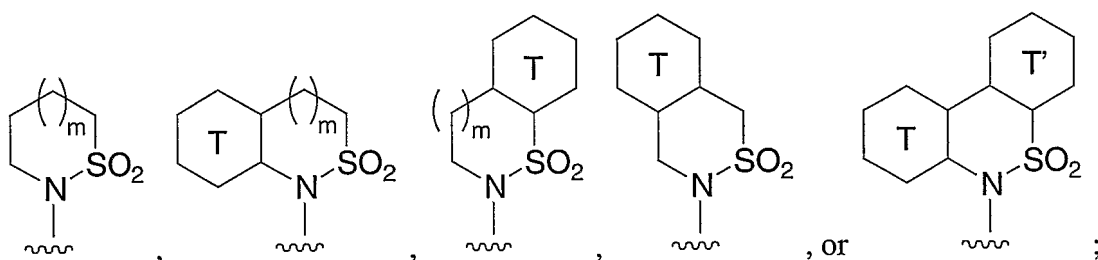
上記式において、* および ** はそれぞれ、ナフチリジン環における環炭素 7 および 8 に対する縮合個所を示し；Y は $-C(R^c)(R^d)-$ または $-B(R^e)-$ であり；

X がハロゲンであり；

R^4 が、 $-H$ 、 $-C_{1-6}$ 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、 $-O-C_{1-6}$ アルキル、 $-O-C_{1-6}$ ハロアルキル、 $-OH$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)R^a$ 、 $-CO_2R^a$ 、 $-SR^a$ 、 $-N(R^b)_2$ 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、 $-C_{1-6}$ アルキル、 $-C_{1-6}$ ハロアルキル、 $-O-C_{1-6}$ アルキル、 $-O-C_{1-6}$ ハロアルキル、 $-OH$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)R^a$ 、 $-CO_2R^a$ 、 $-SR^a$ 、 $-N(R^b)_2$ 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；

R^5 が、 C_{1-6} 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、 $-O-C_{1-6}$ アルキル、 $-O-C_{1-6}$ ハロアルキル、 $-OH$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)R^a$ 、 $-CO_2R^a$ 、 $-SR^a$ 、 $-N(R^b)_2$ 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、 $-C_{1-6}$ アルキル、 $-C_{1-6}$ ハロアルキル、 $-O-C_{1-6}$ アルキル、 $-O-C_{1-6}$ ハロアルキル、 $-OH$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)R^a$ 、 $-CO_2R^a$ 、 $-SR^a$ 、 $-N(R^b)_2$ 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、 R^4 と R^5 がそれらが結合している $-NSO_2-$ 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、部分不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、 $-C_{1-6}$ アルキル、 $-C_{1-6}$ ハロアルキル、 $-O-C_{1-6}$ アルキル、 $-O-C_{1-6}$ ハロアルキル、 $-OH$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)R^a$ 、 $-CO_2R^a$ 、 $-SR^a$ 、 $-N(R^b)_2$ 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；

R^6 が、 $-H$ または $-C_{1-6}$ アルキルであり；前記アルキルは、ハロゲン、 $-O-C_{1-6}$ アルキル、 $-O-C_{1-6}$ ハロアルキル、 $-N(R^b)_2$ および $-CO_2R^a$ 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；

R^7 が、 $-H$ 、 $-C_{1-6}$ 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、 $-O-C_{1-6}$ アルキル、 $-O-C_{1-6}$ ハロアルキル、 $-OH$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)R^a$ 、 $-CO_2R^a$ 、 $-SR^a$ 、 $-N(R^b)_2$ 、 $-C(=O)N(R^a)_2$ 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、それぞれが独立にハロゲン、 $-C_{1-6}$ アルキル、 $-C_{1-6}$ ハロアルキル、 $-O-C_{1-6}$ アルキル、 $-O-C_{1-6}$ ハロアルキル、 $-OH$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)R^a$ 、 $-CO_2R^a$ 、 $-SR^a$ 、 $-N(R^b)_2$ 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 $-C_{1-6}$ アルキルであり；

各 R^b が独立に、 $-C_{1-6}$ アルキルであり；

R^c および R^d がそれぞれ独立に、 $-H$ またはそれぞれが独立にハロゲン、 $-O-C_{1-6}$ アルキルまたは $-O-C_{1-6}$ 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 $-C_{1-6}$ アルキルであり；

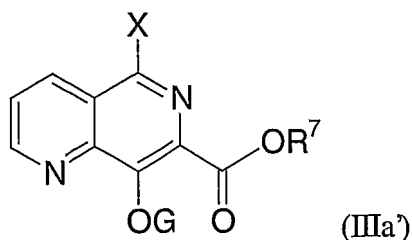
R^e が、 $-C_{1-6}$ アルキル、 $-O-C_{1-6}$ アルキル、アリールまたは $-O$ -アリールであり；前記アルキルは、それぞれが独立にハロゲン、 $-O-C_{1-6}$ アルキルまたは $-O-C_{1-6}$ ハロアルキルである 1 から 7 個の置換基で置換されていても良く；前記アリールは、それぞれが独立にハロゲン、 $-C_{1-6}$ アルキル、 $-C_{1-6}$ ハロアルキル、 $-O-C_{1-6}$ アルキル、 $-O-C_{1-6}$ ハロアルキル、 $-OH$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-CHO$ 、 $-C(=O)-C_{1-6}$ アルキル、 $-CO_2H$ 、 $-CO_2-C_{1-6}$ アルキル、 $-SH$ 、 $-S-C_{1-6}$ アルキル、 $-N(-C_{1-6} \text{ アルキル})_2$ 、 $-C(=O)NH_2$ または $-C(=O)N(-C_{1-6} \text{ アルキル})_2$ 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】

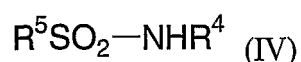
(C) 下記式 (IIIa) の化合物：

【化 9】



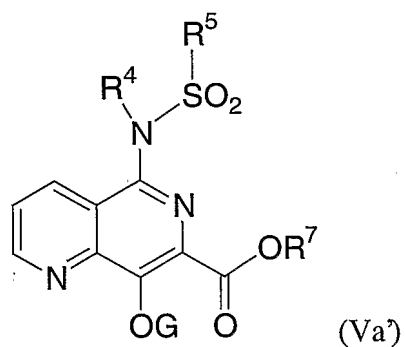
を、溶媒中ならびに銅系促進剤および銅系キレート剤の存在下に下記式 (IV) のスルホンアミド：

【化 10】



と反応させて、下記式 (Va) の化合物：

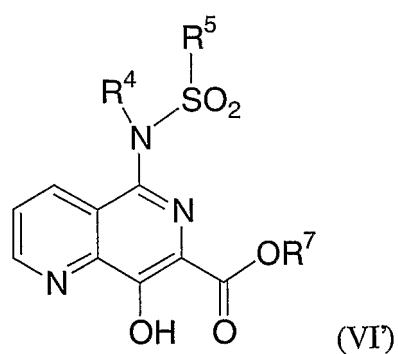
【化 1 1】



を得る段階；

(D 1) 化合物 V a をフェノール脱保護剤で処理して、下記式 (V I) の化合物：

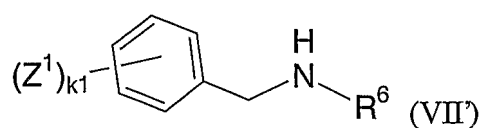
【化 1 2】



を得る段階；および

(D 2) 化合物 V I を下記式 (V I I) のアミン：

【化 1 3】



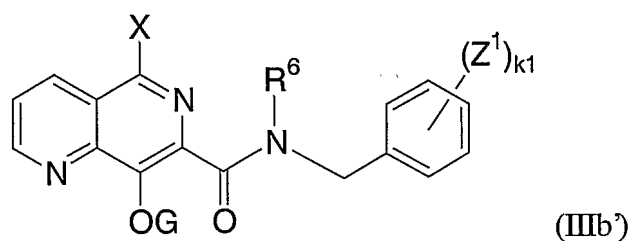
とカップリングさせて、化合物 V I I I を得る段階

を含む化合物 V I I I の製造方法である請求項 1 に記載の方法。

【請求項 3】

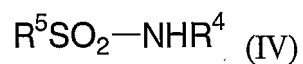
(C) 下記式 (I I I b) の化合物：

【化 1 4】



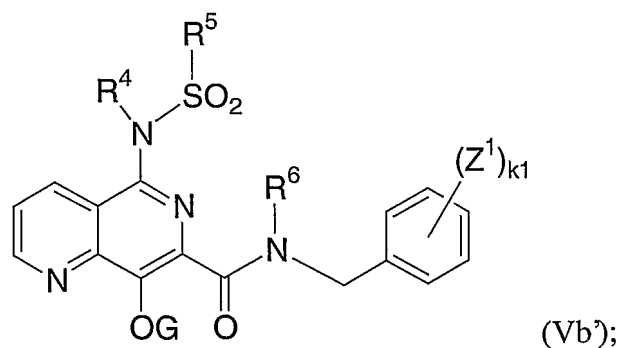
を、溶媒中ならびに銅系促進剤および銅系キレート剤の存在下に下記式 (I V) のスルホンアミド：

【化 1 5】



と反応させて、下記式 (V b) の化合物：

【化 1 6】



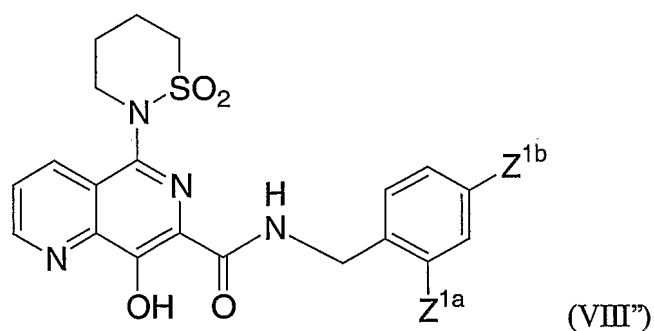
を得る段階；

(E) 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 を得る段階を含む化合物 V I I I 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 (V I I I) の化合物：

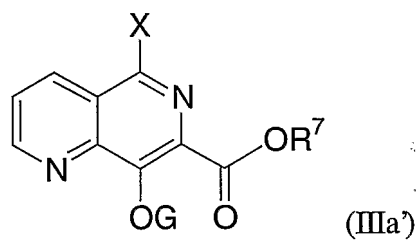
【化 1 7】



の製造方法であって、

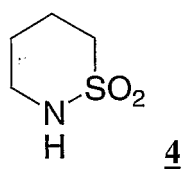
(C) 下記式 (I I I a) の化合物：

【化 1 8】



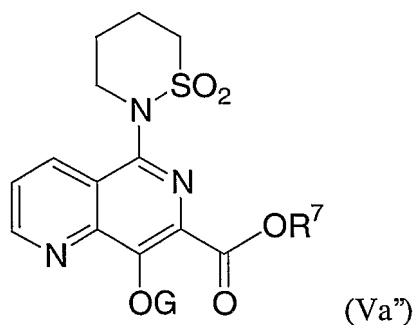
を、溶媒中ならびに銅系促進剤および銅系キレート剤の存在下にスルタム 4：

【化 19】



と反応させて下記式 (V a) の化合物：

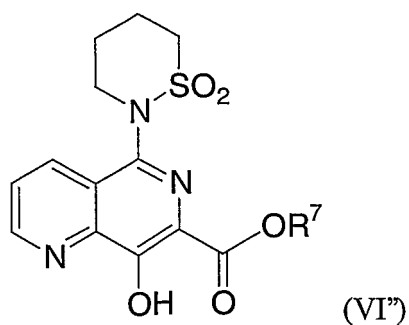
【化 20】



を得る段階；

(D 1) 化合物 V a をフェノール脱保護剤で処理して、下記式 (V I) の化合物：

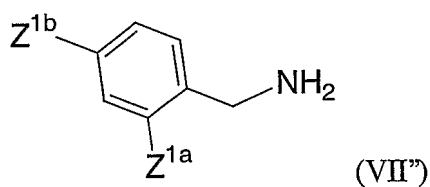
【化 21】



を得る段階；および

(D 2) 化合物 V I を下記式 (V I I) のアミン：

【化 22】



とカップリングさせて、化合物 V I I I を得る段階を含み；

G がフェノール保護基であり；

X がハロゲンであり；

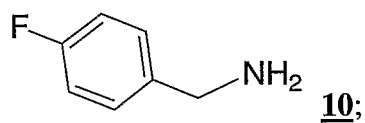
Z^{1a} および Z^{1b} がそれぞれ独立に、-H またはハロゲンであり；R⁷ が -C₁₋₆ アルキル、フェニルまたはベンジルである、前記方法。

【請求項 5】

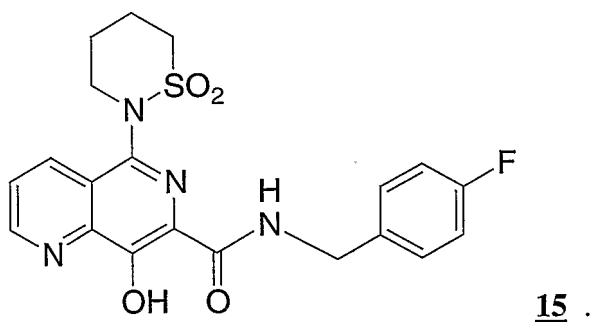
化合物 V a または V b 上の前記 -OG 基がエーテル、シリルエーテル、カルボン酸エス

【請求項 6】

【化 2 3】

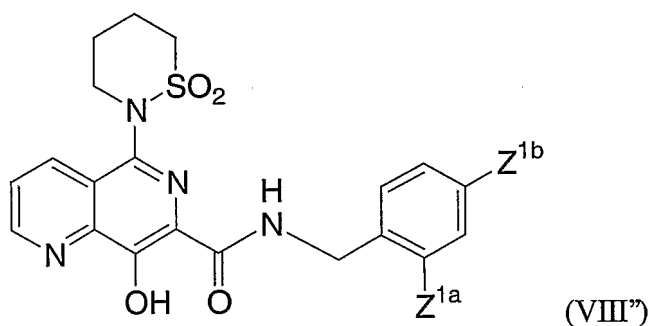


【化 2 4】

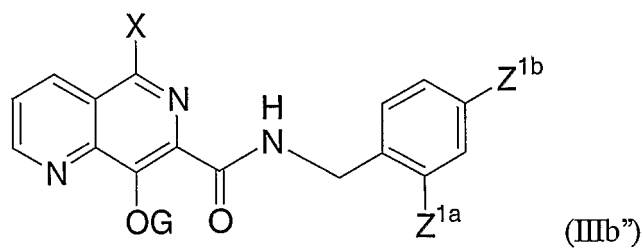


【請求項 7】

【化 2 5】

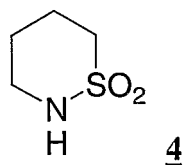


【化 2 6】



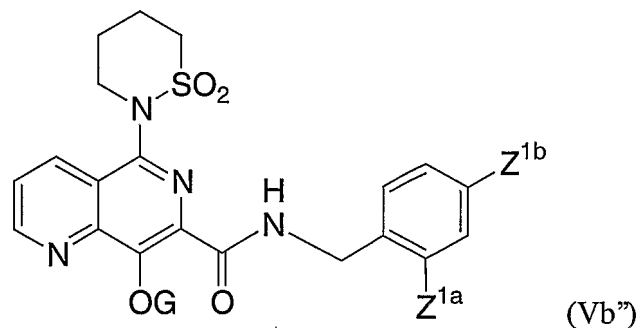
を、溶媒中ならびに銅系促進剤および銅系キレート剤の存在下にスルタム 4 :

【化 2 7】



と反応させて下記式 (V b) の化合物：

【化 2 8】



を得る段階；および

(E) 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；

G がフェノール保護基であり；

X がハロゲンであり；

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

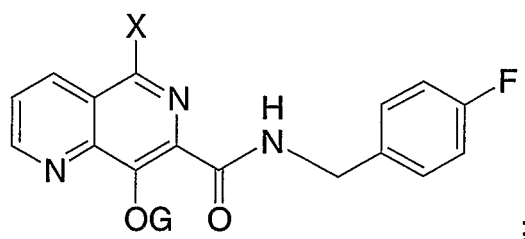
【請求項 8】

化合物 V a または V b 上の前記 - O G 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 I I b が：

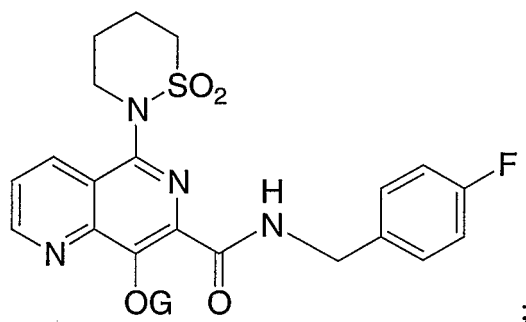
【化 2 9】



であり；

段階 E での化合物 V b が：

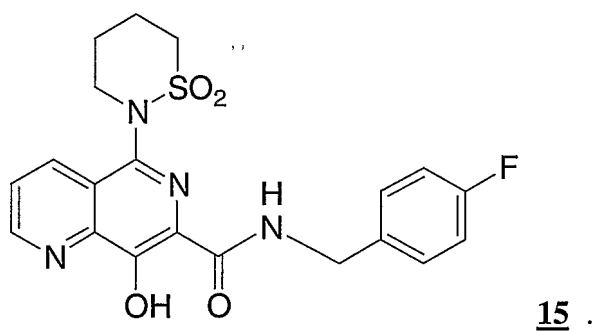
【化 3 0】



であり；

化合物 V I I I が化合物 1 5：

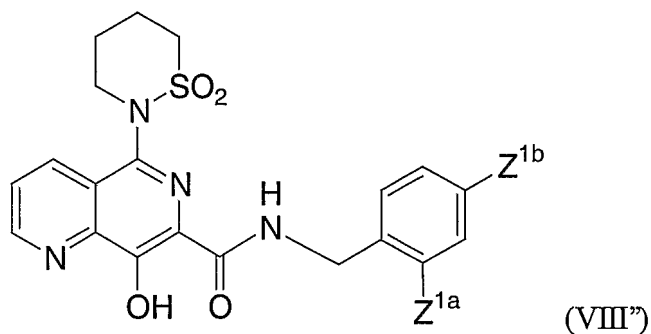
【化 3 1】

15 .である請求項 7 に記載の方法。

【請求項 1 0】

下記式 (V I I I) の化合物：

【化 3 2】

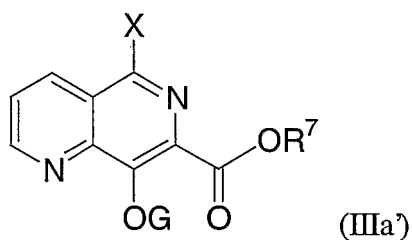


(VIII')

の製造方法であって、

(C) 下記式 (I I I a) の化合物：

【化 3 3】

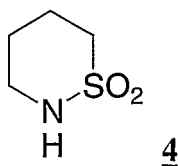


(IIIa')

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

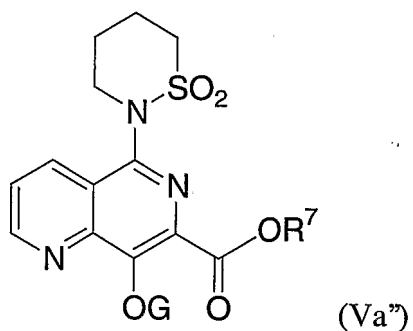
スルタム 4 :

【化 3 4】



と反応させて、下記式 (V a) の化合物 :

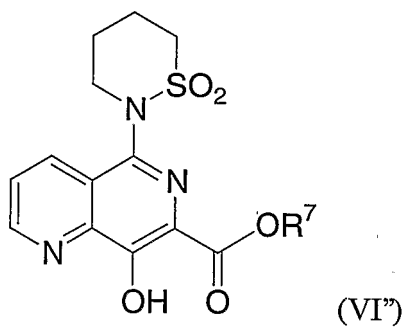
【化 3 5】



を得る段階 ;

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

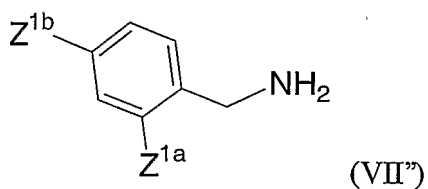
【化 3 6】



を得る段階 ; ならびに

(D 2) 化合物 V I を下記式 (V I I) の化合物 :

【化 3 7】



とカップリングさせて化合物 V I I I を得る段階を含み ;

G がフェノール保護基であり ; X がハロゲンであり ; Z^{1 a} および Z^{1 b} がそれぞれ独立に - H またはハロゲンであり ; 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。