

【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29年1月12日(2017.1.12)

【公表番号】特表2016-501211(P2016-501211A)

【公表日】平成28年1月18日(2016.1.18)

【年通号数】公開・登録公報2016-004

【出願番号】特願2015-544484(P2015-544484)

【国際特許分類】

C 0 7 D 209/88 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 209/88

【手続補正書】

【提出日】平成28年11月18日(2016.11.18)

【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

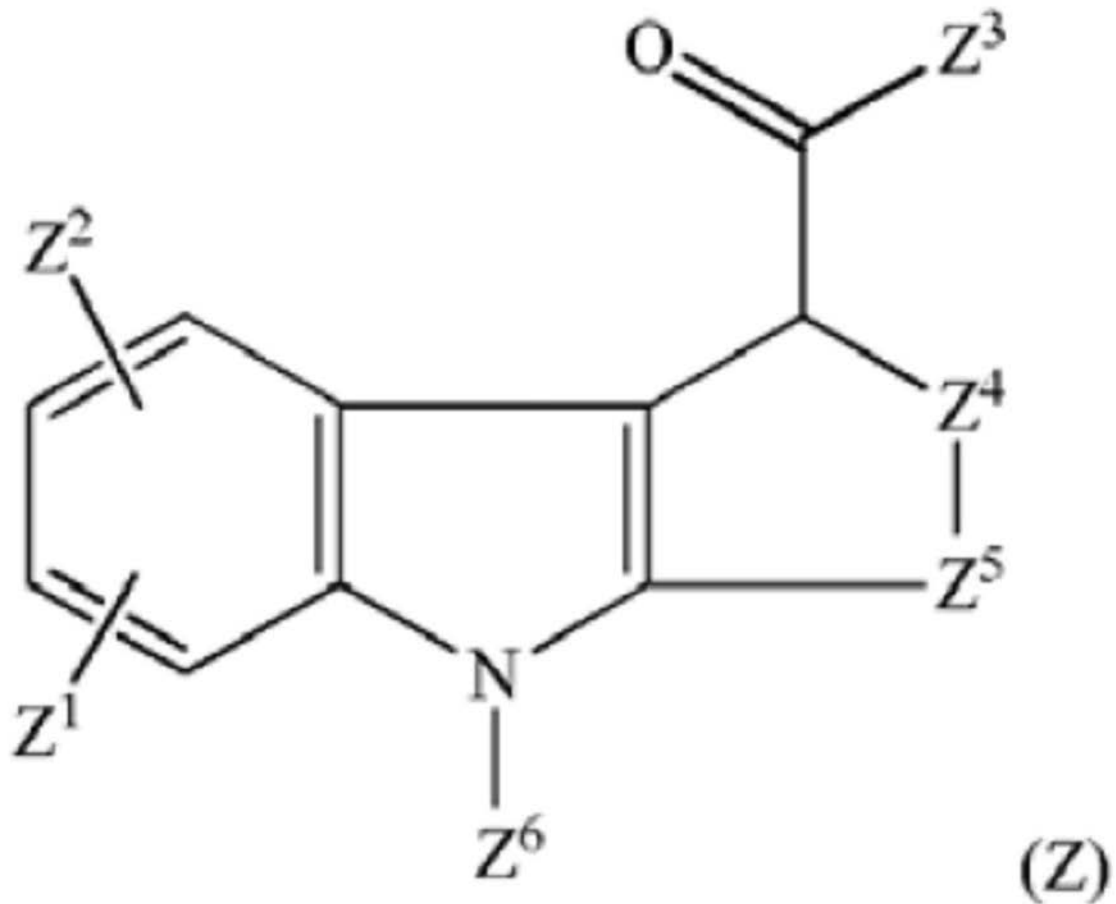
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

下記の式Zの化合物の製造方法であって、下記の式Yの化合物の環化を含んでいて、環化が、式Yの化合物の溶液に、適当な溶媒中のハロゲン化亜鉛を導入することによって実施され、導入が、第1の添加と、その少なくとも6時間後に実施される第2の添加とを含んでいる、方法。

## 【化 1】



式中、

$Z^1$ は、ハロ又は $C_{1-3}$ アルキルから選択される $R^1$ 基であり、

$Z^2$ は、水素、ヒドロキシル、ハロ、シアノ、 $C_{1-3}$ アルキル、 $C_{1-3}$ アルコキシ、 $C_{1-3}$ フルオロアルキル又は $C_{1-3}$ フルオロアルコキシから選択される $R^2$ 基であり、

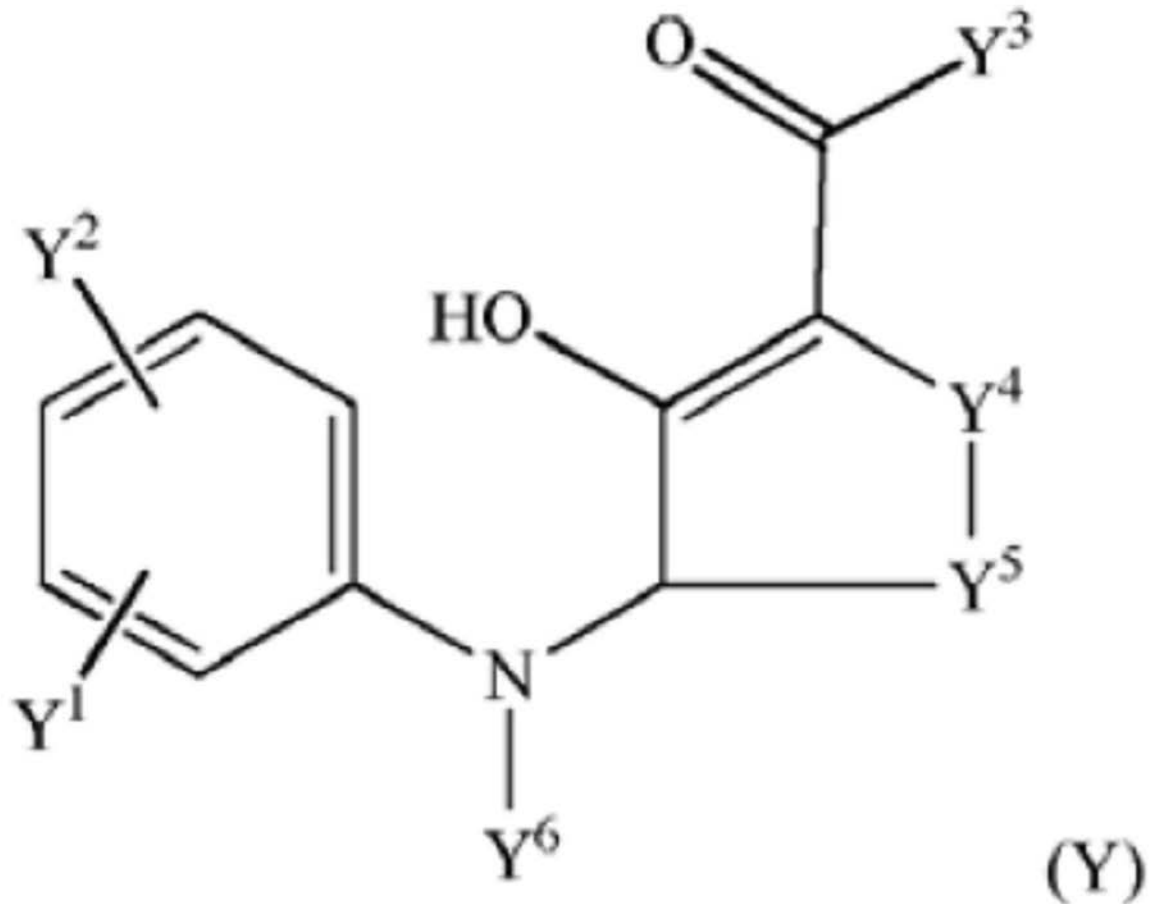
$Z^3$ は、 $C_{1-6}$ アルキル又は $-O-R^7$ （式中、 $R^7$ は $C_{1-6}$ アルキルである。）から選択される $R^3$ 基であり、

$Z^4$ は、O、S、SO、 $SO_2$ 又は $CH_2$ から選択される $R^4$ 基であり、

$Z^5$ は、 $CH_2$ 、 $CH_2-CH_2$ 、 $CH(CH_3)-CH_2$ 又は $CH_2-CH_2-CH_2$ から選択される $R^5$ 基であり、

$Z^6$ は、 $-O-R^8$ 基（式中、 $R^8$ は $C_{1-10}$ アルキル、 $C_{3-12}$ アリール、 $C_{7-14}$ アリールアルキル又はヒドロキシル保護基である。）である $R^6$ である。

## 【化 2】



式中、各  $Y^{1-6}$  は、各  $Z^{1-6}$  と同一である。

## 【請求項 2】

$R^1$  基が、それが結合したアリール環の底部にある、請求項 1 記載の方法。

## 【請求項 3】

$R^2$  基が、それが結合したアリール環の頂部にある、請求項 1 又は請求項 2 記載の方法

。

## 【請求項 4】

$R^1$  基がハロゲンである、請求項 1 乃至請求項 3 のいずれか 1 項記載の方法。

## 【請求項 5】

$R^2$  基が、 $C_{1-3}$  アルコキシ、 $C_{1-3}$  又は  $C_{1-3}$  フルオロアルコキシである、請求項 1 乃至請求項 4 のいずれか 1 項記載の方法。

## 【請求項 6】

$R^3$  基が  $-O-R^7$  (式中、 $R^7$  は  $C_{1-6}$  アルキルである。) である、請求項 1 乃至請求項 5 のいずれか 1 項記載の方法。

## 【請求項 7】

$R^7$  が  $C_{1-3}$  アルキルである、請求項 6 記載の方法。

## 【請求項 8】

$R^8$  がヒドロキシル保護基である、請求項 1 記載の方法。

## 【請求項 9】

$R^8$  がベンジルである、請求項 8 記載の方法。

## 【請求項 10】

ハロゲン化亜鉛が塩化亜鉛である、請求項 1 乃至請求項 9 のいずれか 1 項記載の方法。

## 【請求項 1 1】

式 Z の - C ( = O ) - Z<sup>3</sup>基を - C ( = O ) - Z<sup>13</sup>基 ( 式中、Z<sup>13</sup>は、ヒドロキシル又は NR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>であり、ここで、R<sup>9</sup>及び R<sup>10</sup>は独立に C<sub>1-3</sub>アルキル、C<sub>7-10</sub>アリアルアルキルであるか、或いは R<sup>9</sup>及び R<sup>10</sup>はそれらが結合した窒素と共に、窒素、酸素及び硫黄から選択される 1 個の別のヘテロ原子を任意選択で含む含窒素 C<sub>4-6</sub>脂肪族環を形成する。 ) に転化させることをさらに含む、請求項 1 乃至請求項 1 0 のいずれか 1 項記載の方法。

## 【請求項 1 2】

- N - Z<sup>6</sup>基を - N - Z<sup>16</sup>基 ( 式中、Z<sup>16</sup>は、水素、C<sub>1-10</sub>アルキレン - OH、又は L G が脱離基である C<sub>1-10</sub>アルキレン - LG である。 ) に転化させることをさらに含む、請求項 1 乃至請求項 1 1 のいずれか 1 項記載の方法。

## 【請求項 1 3】

Z<sup>16</sup>が C<sub>1-10</sub>アルキレン - LG である、請求項 1 2 記載の方法。

## 【請求項 1 4】

LG が、ハロ或いはアリアル又はアルキルスルホン酸である、請求項 1 3 記載の方法。

## 【請求項 1 5】

- N - Z<sup>16</sup>基を - N - Z<sup>26</sup>基 ( 式中、Z<sup>26</sup>は C<sub>1-10</sub>アルキレン - <sup>18</sup>F である。 ) に転化させることをさらに含む、請求項 1 3 記載の方法。