

【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】令和2年3月12日(2020.3.12)

【公表番号】特表2019-502746(P2019-502746A)
 【公表日】平成31年1月31日(2019.1.31)
 【年通号数】公開・登録公報2019-004
 【出願番号】特願2018-538743(P2018-538743)
 【国際特許分類】

C 0 7 D 498/18 (2006.01)
 A 6 1 K 47/68 (2017.01)
 A 6 1 K 31/537 (2006.01)
 A 6 1 P 35/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 498/18 3 1 1
 C 0 7 D 498/18 C S P
 A 6 1 K 47/68
 A 6 1 K 31/537
 A 6 1 P 35/00

【手続補正書】

【提出日】令和2年1月22日(2020.1.22)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0536

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0536】

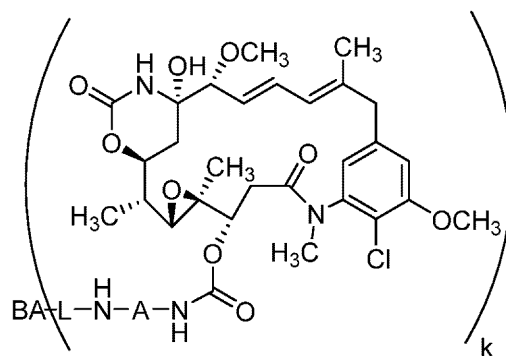
上記の実施態様及び実施例は、単に例示的かつ非限定的であることが意図される。当業者は、具体的な化合物、材料、及び手順の数多くの等価物を認識するか、又はそれらをルーチンの実験だけを用いて確認することができるであろう。そのような等価物は全て、本範囲内にあると考えられ、添付の特許請求の範囲によって包含される。

本件出願は、以下の構成の発明を提供する。

(構成1)

式(1)の化合物又はその医薬として許容し得る塩もしくは立体異性体:

(化1)



(I)

(式中:

Aはアリーレン又はヘテロアリーレンであり;

Lはリンカーであり;

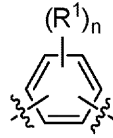
BAは結合剤であり;かつ

kは1~30の整数である)。

(構成2)

Aが:

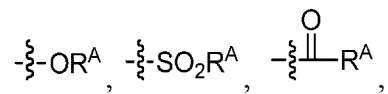
(化2)



であり;

R¹が、出現する毎に独立に、アルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシ、アリー
ル、アルカリール、アリールアルキル、ハロ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ヘテロア
ルキル、ヘテロアリール、ヘテロシクロアルキル、シアノ、ニトロ、

(化3)

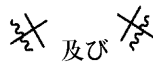


及びアジドから選択され;

R^Aがアルキルであり;

nが0~4の整数であり;かつ

(化4)



が、各々、Aから-NH-への結合を表す、
構成1記載の化合物。

(構成3)

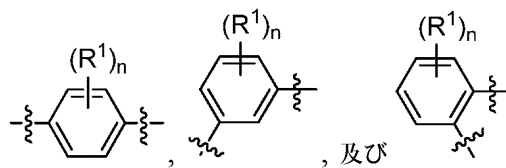
R¹が、出現する毎に独立に、アルキル、アルコキシ、ハロ、ハロアルキル、及びヘテロ
シクロアルキルから選択される、

構成2記載の化合物。

(構成4)

Aが:

(化5)



から選択され;かつ

nが0、1、2、又は3である、

構成2又は3記載の化合物。

(構成5)

R¹が、出現する毎に独立に、メチル、メトキシ、フルオロ、クロロ、プロモ、トリフル
オロメチル、ピロリジニル、及びモルホリニルから選択される、構成2~4のいずれか一項

記載の化合物。

(構成 6)

R¹がメチルである、構成2~5のいずれか一項記載の化合物。

(構成 7)

R¹が、出現する毎に独立に、フルオロ、クロロ、及びプロモから選択される、構成2~5のいずれか一項記載の化合物。

(構成 8)

R¹がクロロである、構成2~5のいずれか一項記載の化合物。

(構成 9)

R¹がトリフルオロメチルである、構成2~5のいずれか一項記載の化合物。

(構成 10)

R¹がメトキシである、構成2~5のいずれか一項記載の化合物。

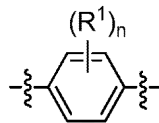
(構成 11)

R¹が、出現する毎に独立に、メチル、モルホリニル、及びピロリジニルから選択される、構成2~5のいずれか一項記載の化合物。

(構成 12)

Aが、

(化 6)

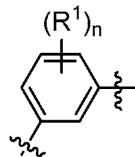


である、構成2~11のいずれか一項記載の化合物。

(構成 13)

Aが、

(化 7)

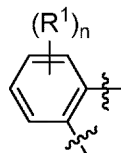


である、構成2~11のいずれか一項記載の化合物。

(構成 14)

Aが、

(化 8)

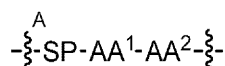


である、構成2~11のいずれか一項記載の化合物。

(構成 15)

Lが:

(化 9)



であり、
ここで:
SPがスペーサーであり;
(化10)



が前記結合剤との1以上の結合であり;
(化11)



がAから-NH-への結合であり;
AA¹がアミノ酸であり;かつ
AA²がアミノ酸である、
構成1~14のいずれか一項記載の化合物。
(構成16)

Lが:
(化12)



であり、
ここで:
SPがスペーサーであり;
(化13)



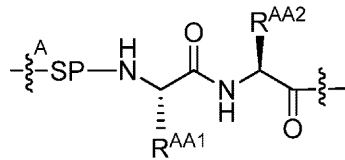
が前記結合剤との1以上の結合であり;かつ
(化14)



がAから-NH-への結合である、
構成1~14のいずれか一項記載の化合物。
(構成17)

AA¹-AA²が:バリン-シトルリン、シトルリン-バリン、リジン-フェニルアラニン、フェニルアラニン-リジン、バリン-アスパラギン、アスパラギン-バリン、トレオニン-アスパラギン、アスパラギン-トレオニン、セリン-アスパラギン、アスパラギン-セリン、フェニルアラニン-アスパラギン、アスパラギン-フェニルアラニン、ロイシン-アスパラギン、アスパラギン-ロイシン、イソロイシン-アスパラギン、アスパラギン-イソロイシン、グリシン-アスパラギン、アスパラギン-グリシン、グルタミン酸-アスパラギン、アスパラギン-グルタミン酸、シトルリン-アスパラギン、アスパラギン-シトルリン、アラニン-アスパラギン、アスパラギン-アラニン、バリン-アラニン、アラニン-バリン、バリン-グリシン、又はグリシン-バリンである、構成15記載の化合物。

(構成18)
Lが:
(化15)



であり、

ここで:

SPがスペーサーであり;

(化16)



が前記結合剤との1以上の結合であり;

(化17)



がAから-NH-への結合であり;

R^{AA1}がアミノ酸側鎖であり;かつ

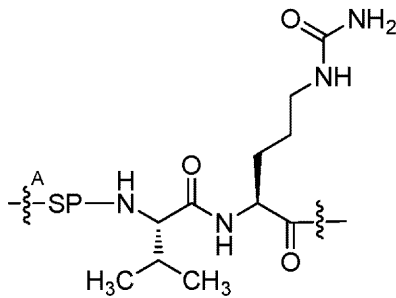
R^{AA2}がアミノ酸側鎖である、

構成1~15のいずれか一項記載の化合物。

(構成19)

Lが:

(化18)



であり、

ここで:

SPがスペーサーであり;かつ

(化19)



が前記結合剤との1以上の結合であり;かつ

(化20)



がAから-NH-への結合である、

構成18記載の化合物。

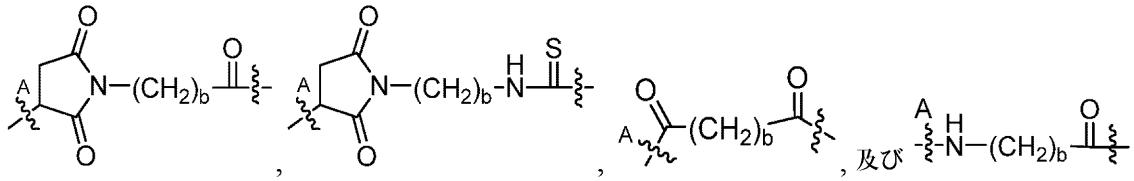
(構成20)

SPがC₅₋₇アルキレンを含む、構成15~19のいずれか一項記載の化合物。

(構成21)

SPが：

(化21)



から選択され；

ここで：

bが、各々の場合に独立に、2~8の整数であり；

(化22)



が前記結合剤との1以上の結合であり；かつ

(化23)



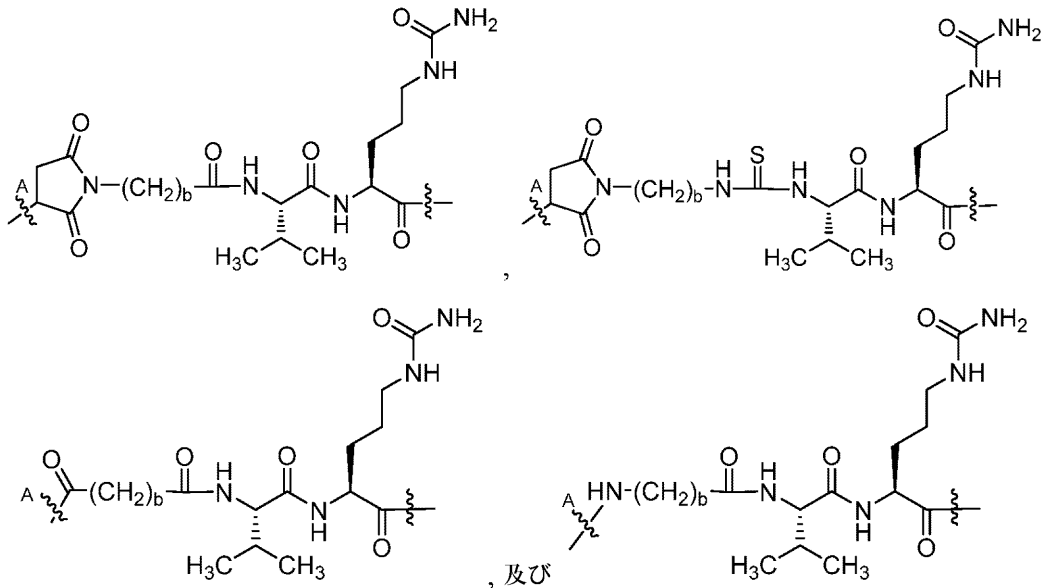
がAから-NH-への結合である、

構成15~20のいずれか一項記載の化合物。

(構成22)

Lが、

(化24)



から選択され；

ここで：

bが、2~8の整数であり；

(化25)



が前記結合剤との1以上の結合であり；かつ

(化26)

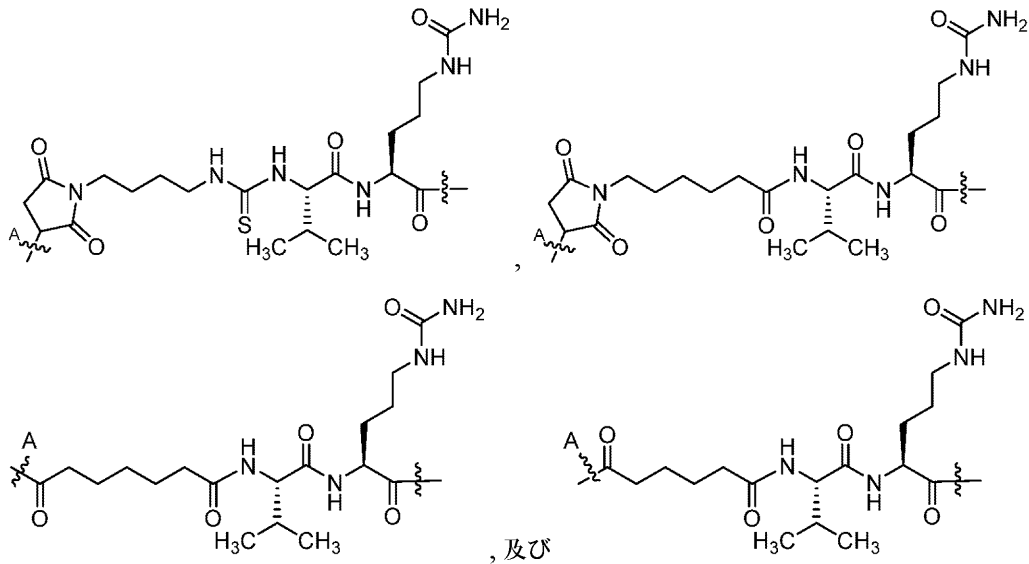


がAから-NH-への結合である、
構成1~15及び17~21のいずれか一項記載の化合物。

(構成23)

Lが、

(化27)



から選択され、

ここで、

(化28)



が、前記結合剤との結合であり、かつ

(化29)

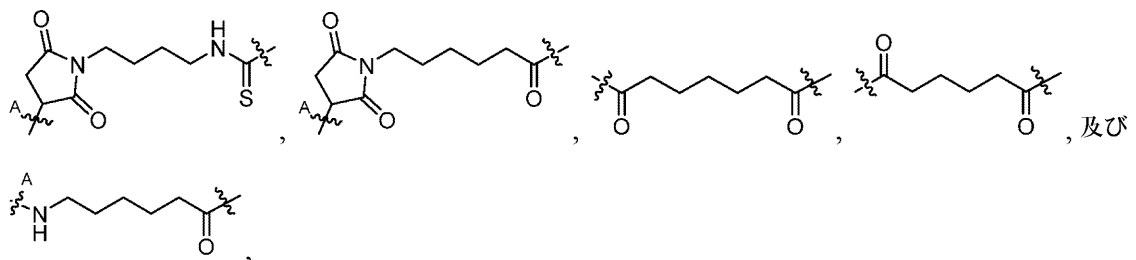


がAから-NH-への結合である、
構成22記載の化合物。

(構成24)

Lが、

(化30)



から選択され、ここで、
(化31)

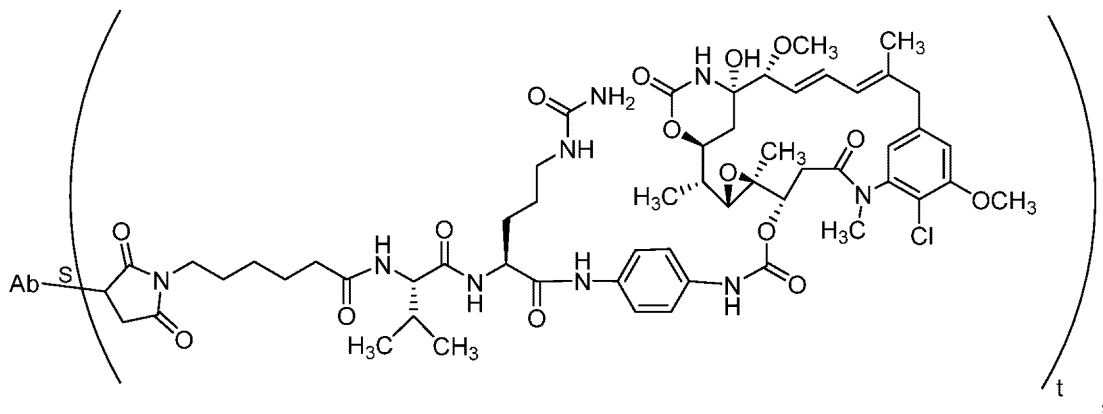


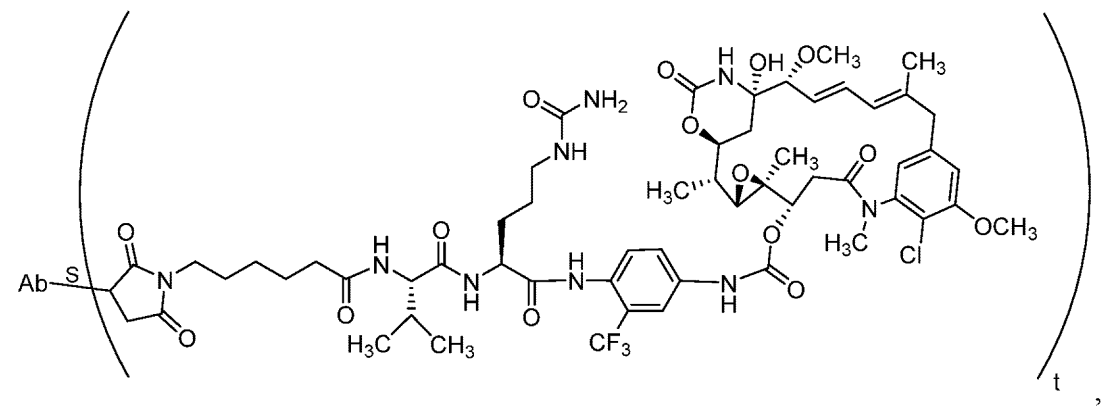
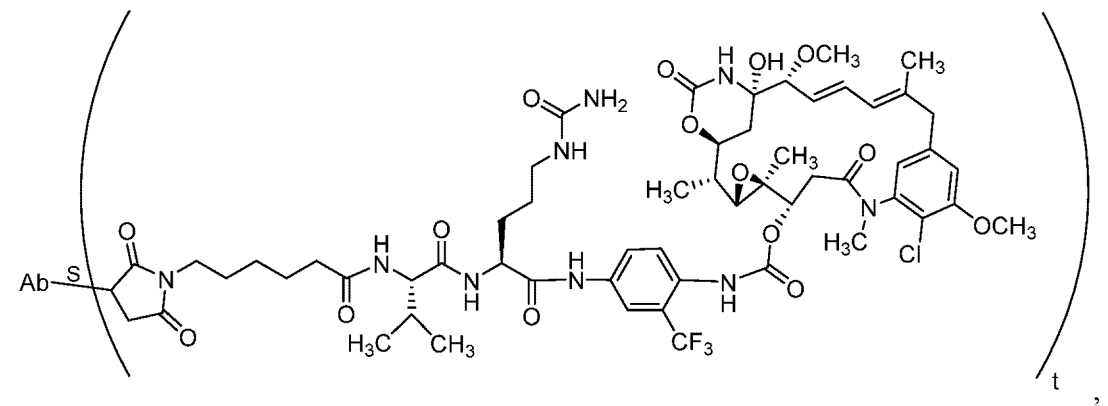
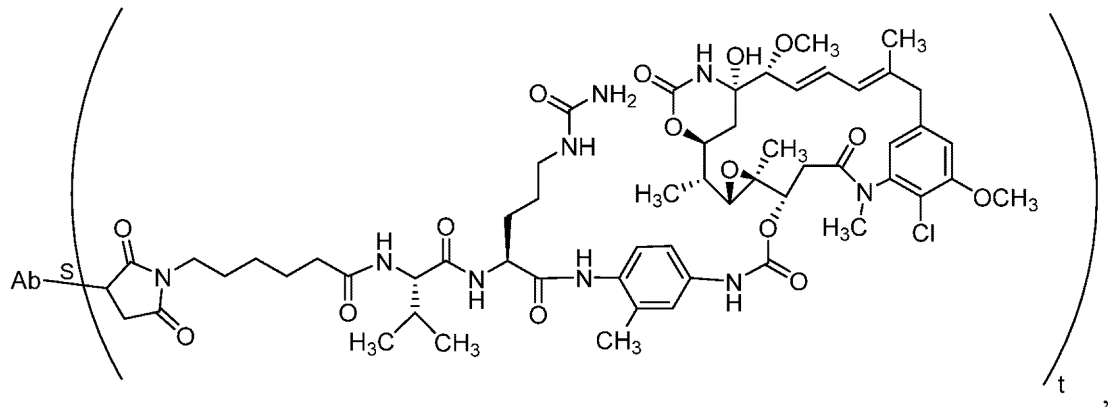
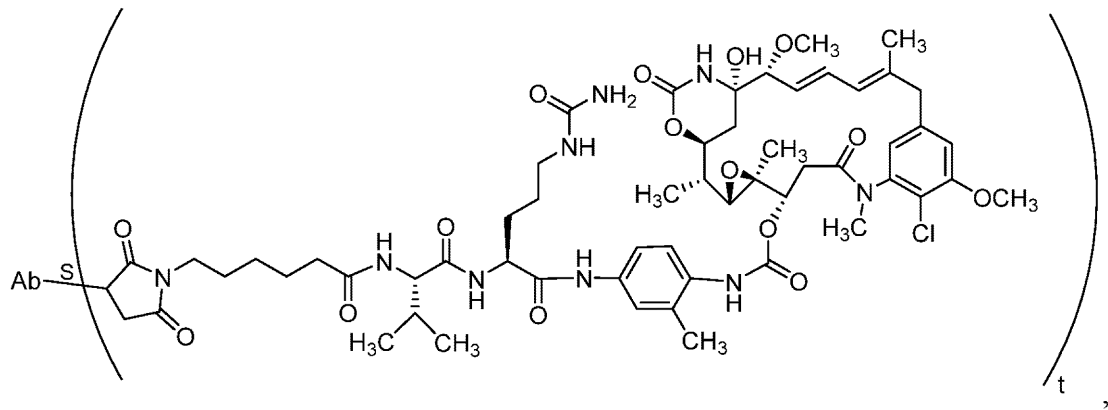
が、前記結合剤との結合であり、かつ
(化32)

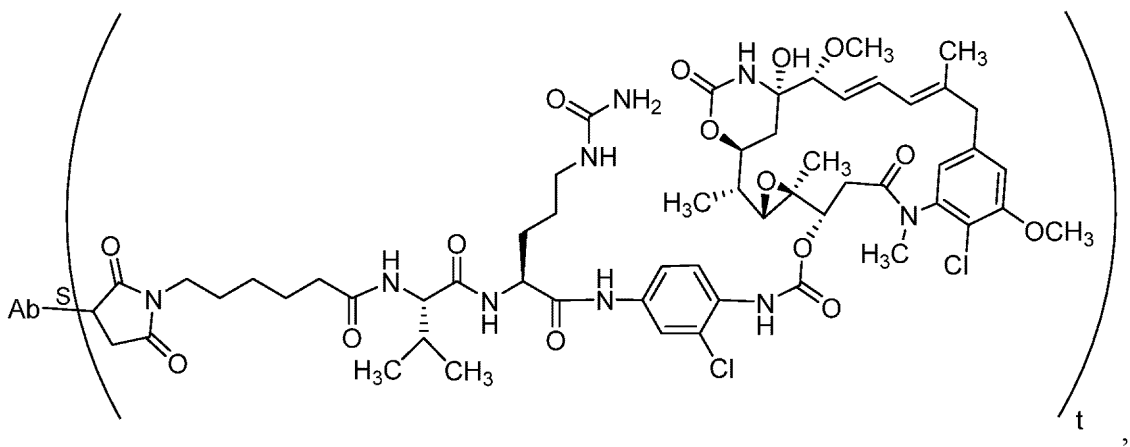
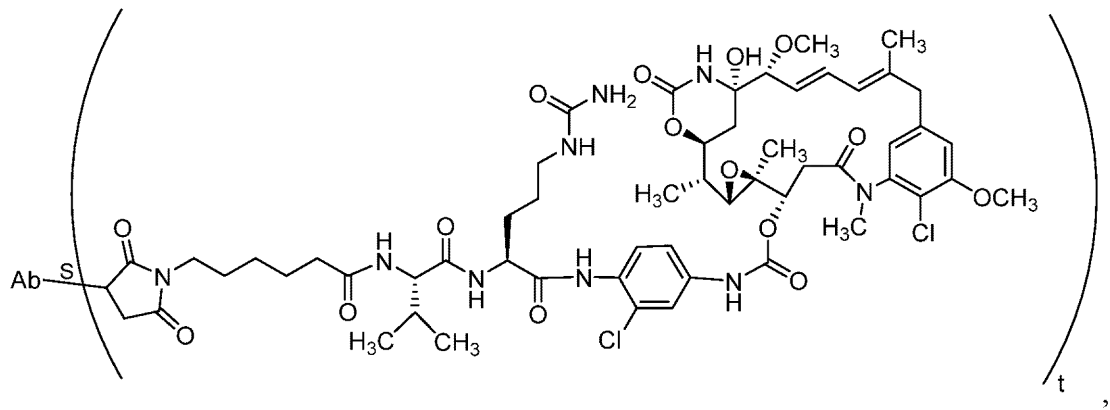
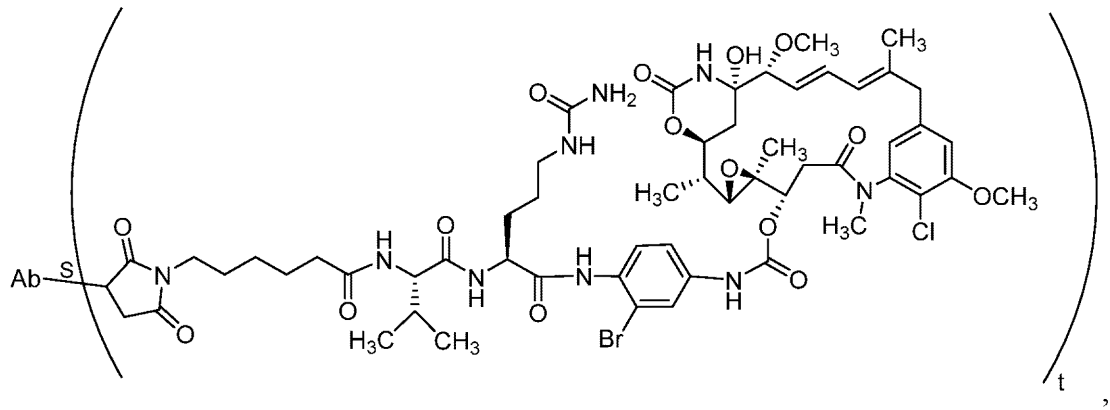
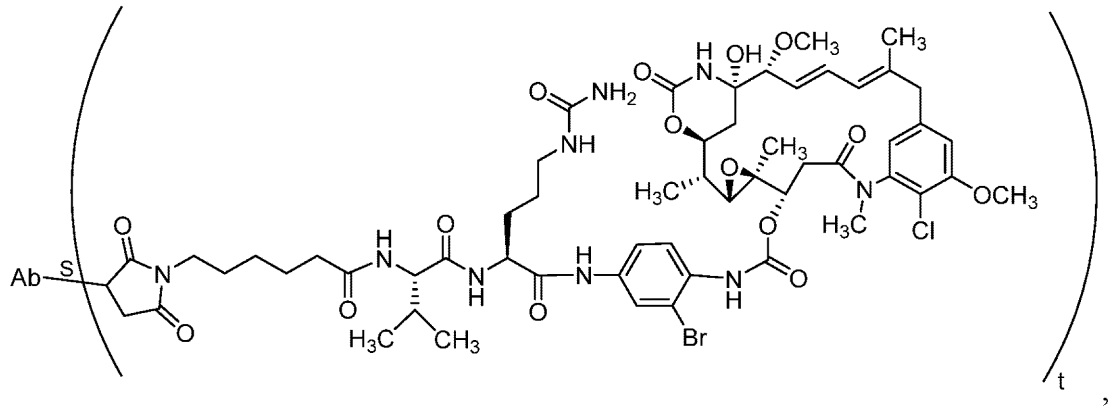


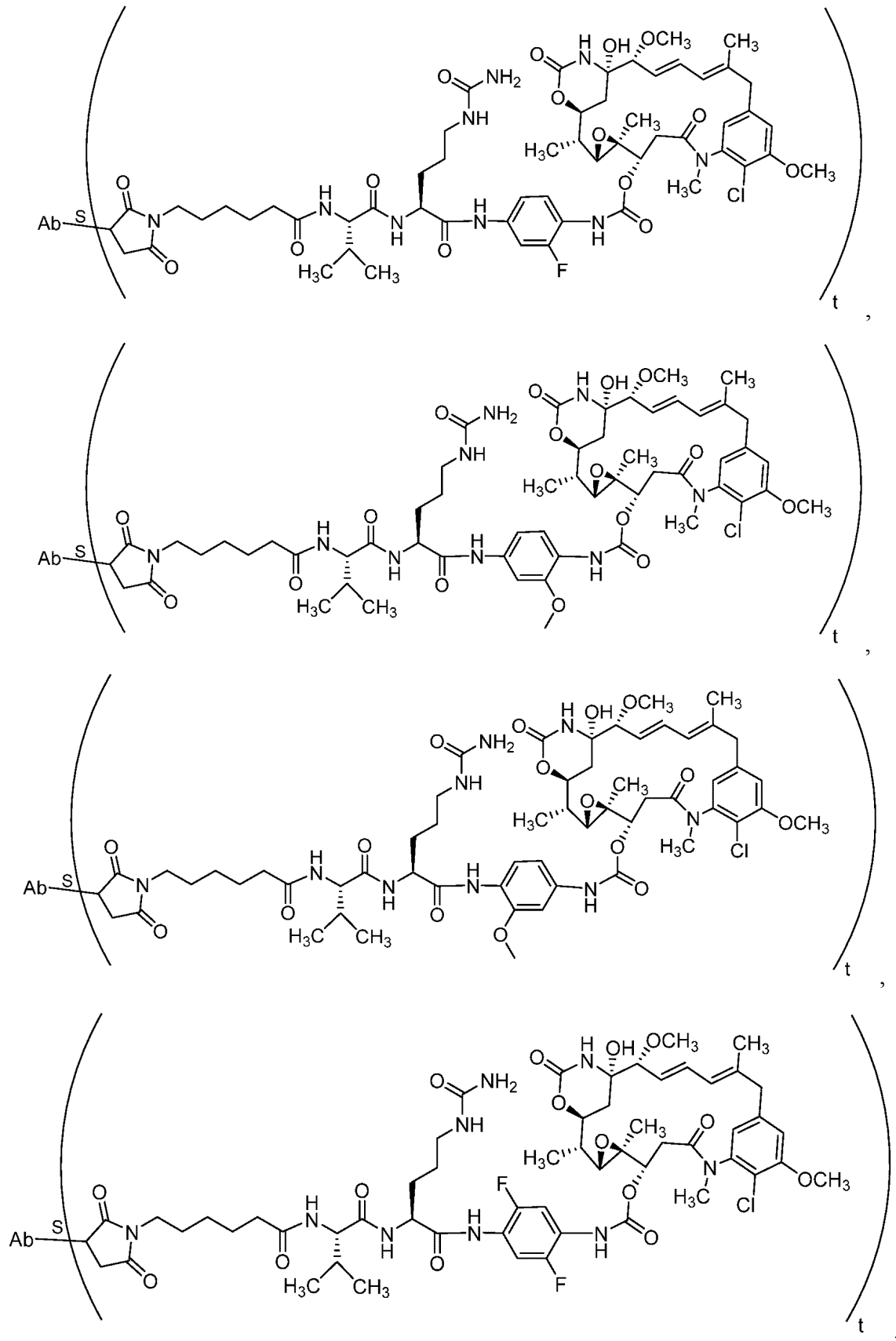
がAから -NH- への結合である、構成1～14、16、及び20～21のいずれか一項記載の化合物。

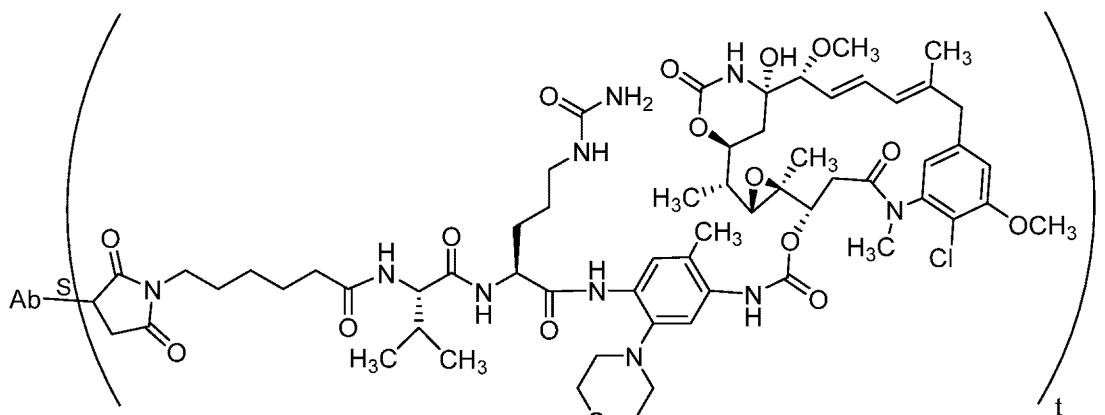
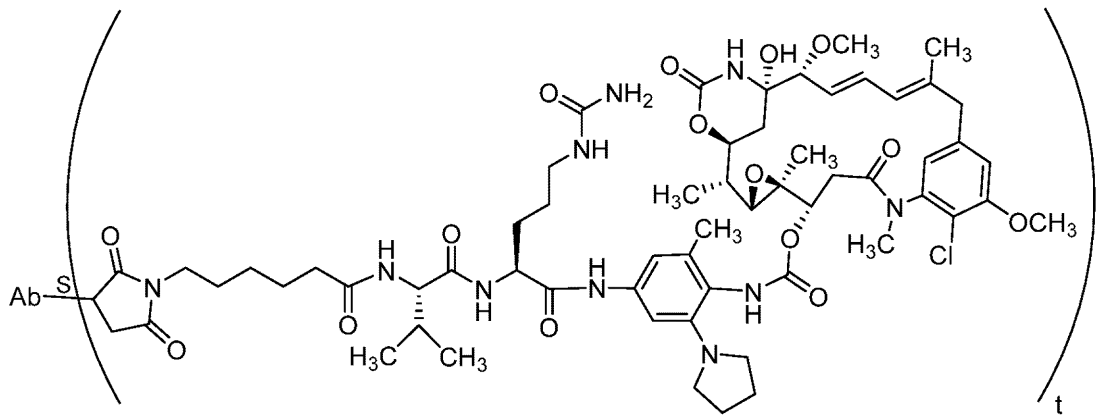
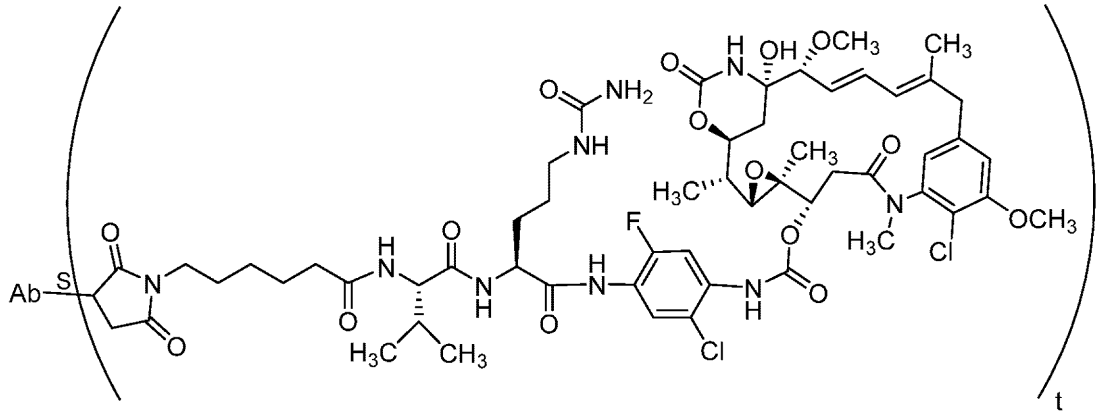
(構成25)
前記化合物が：
(化33)

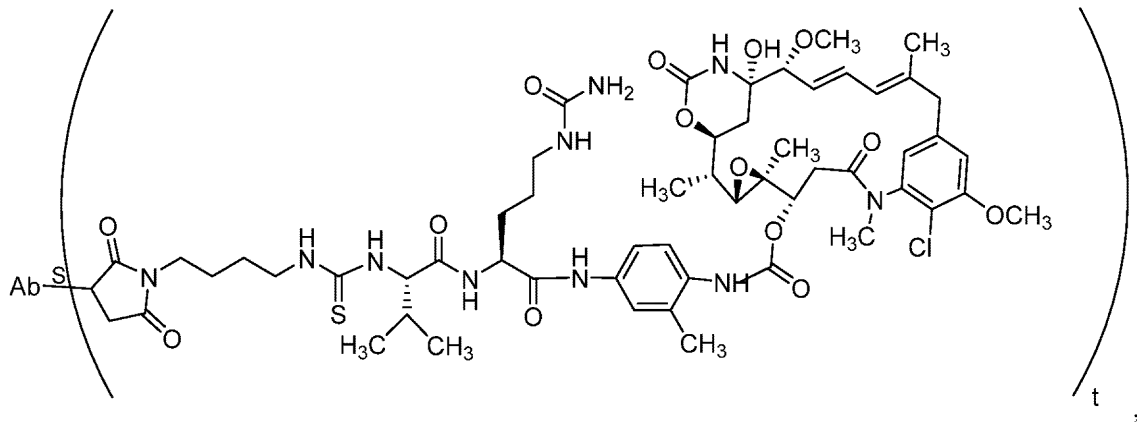
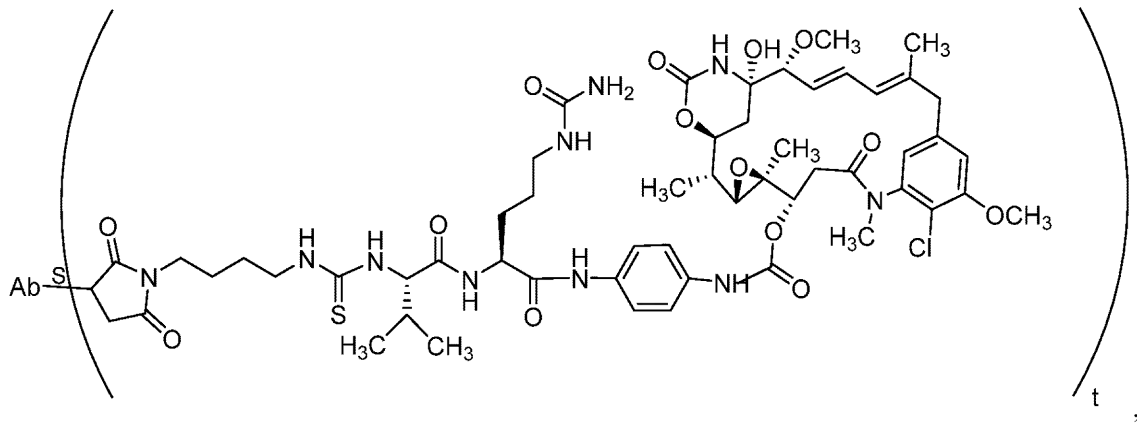
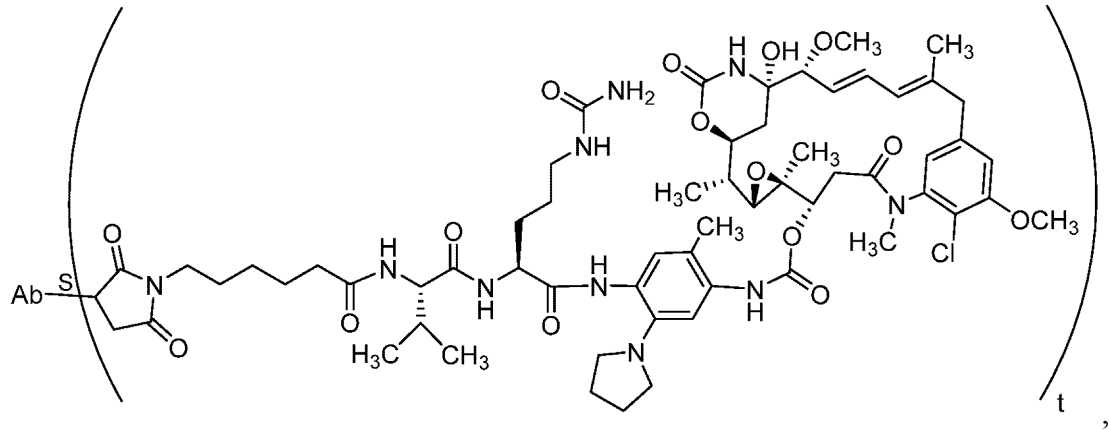


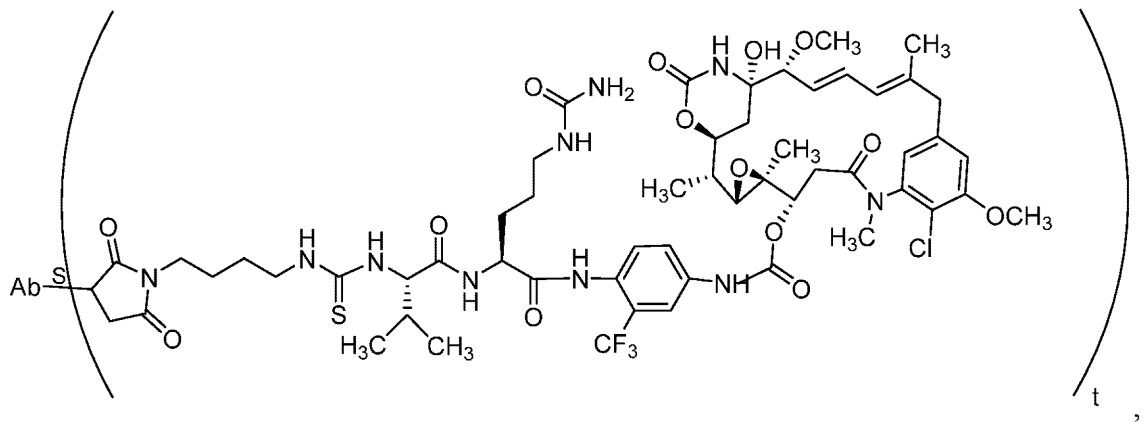
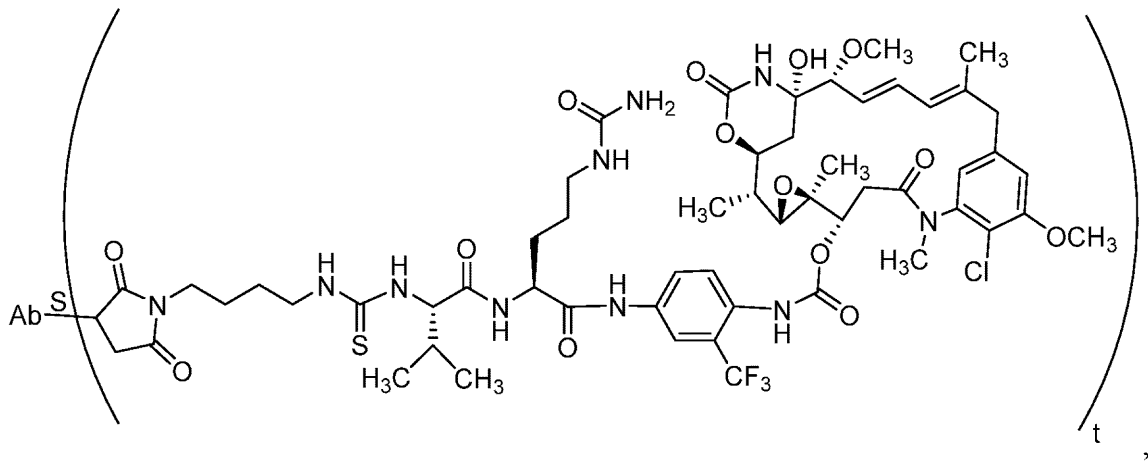
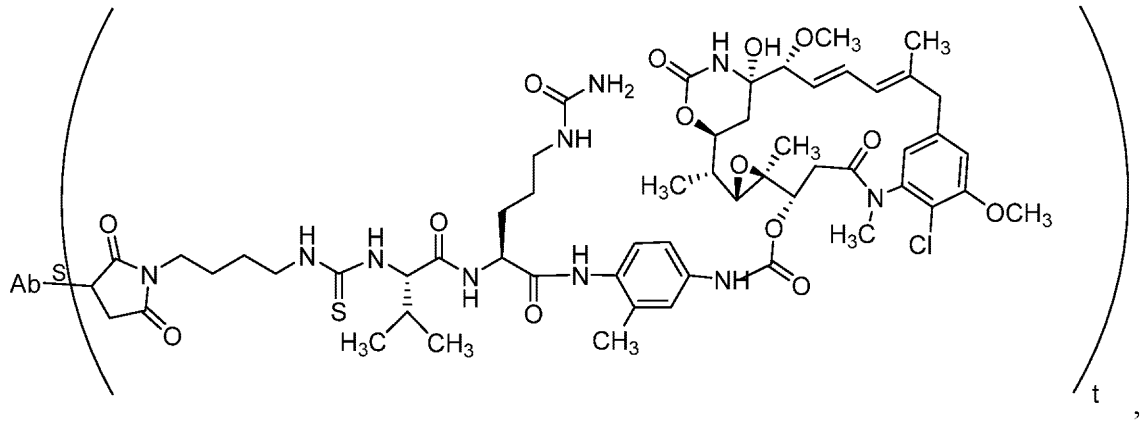


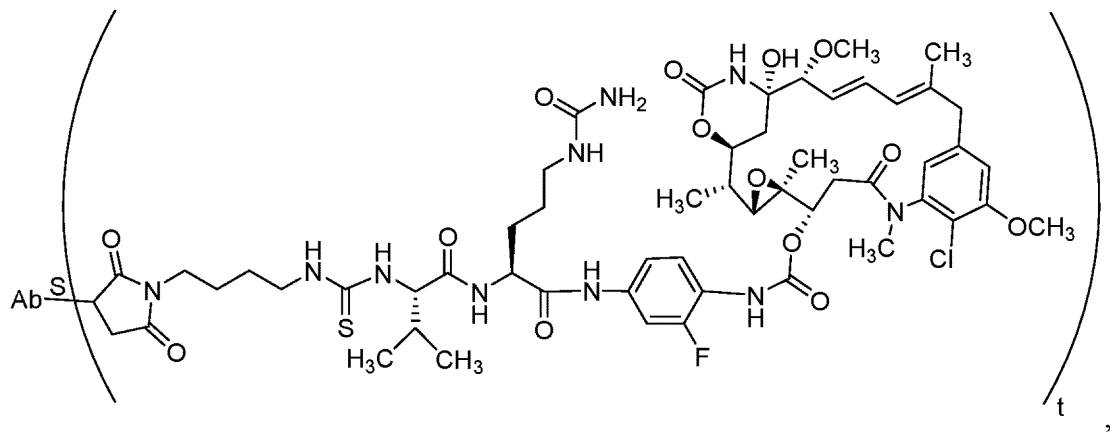
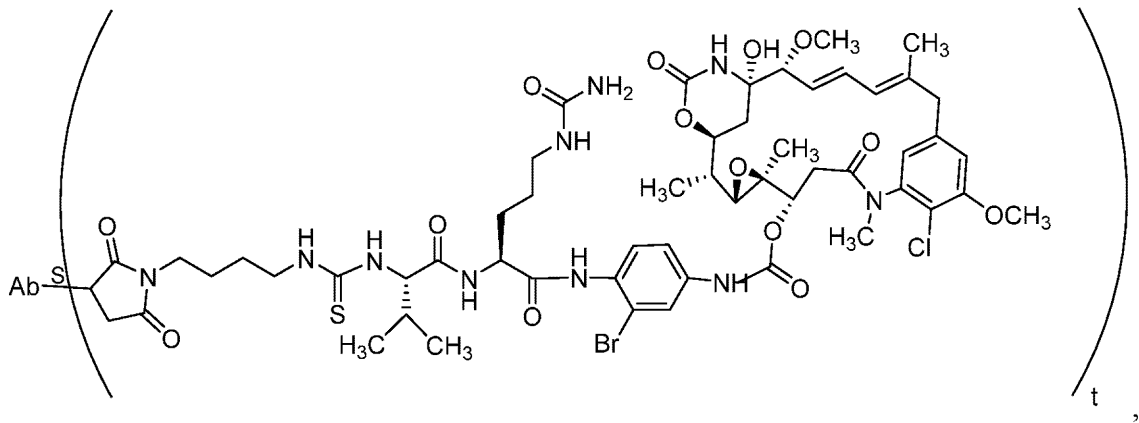
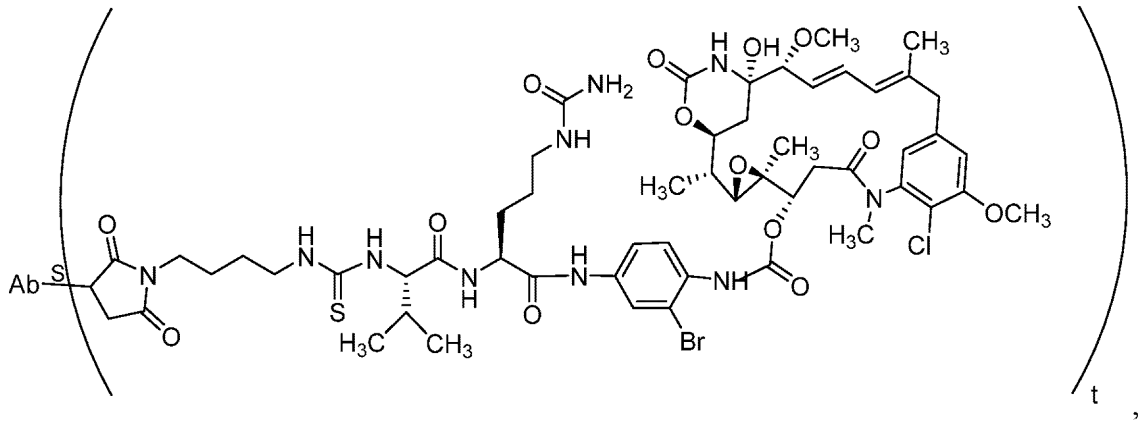


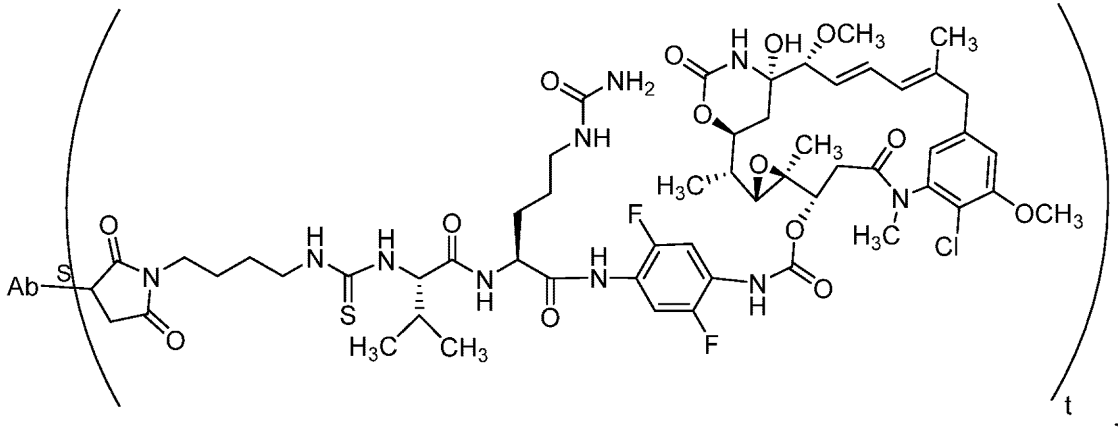
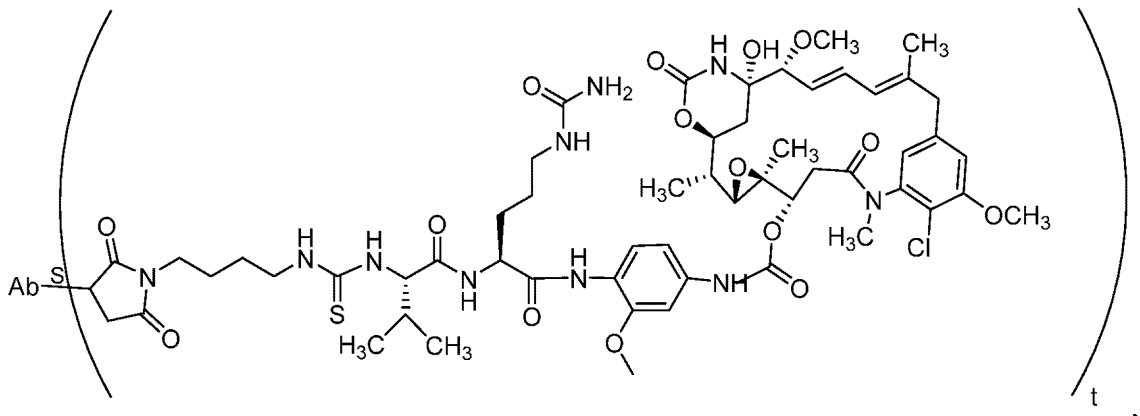
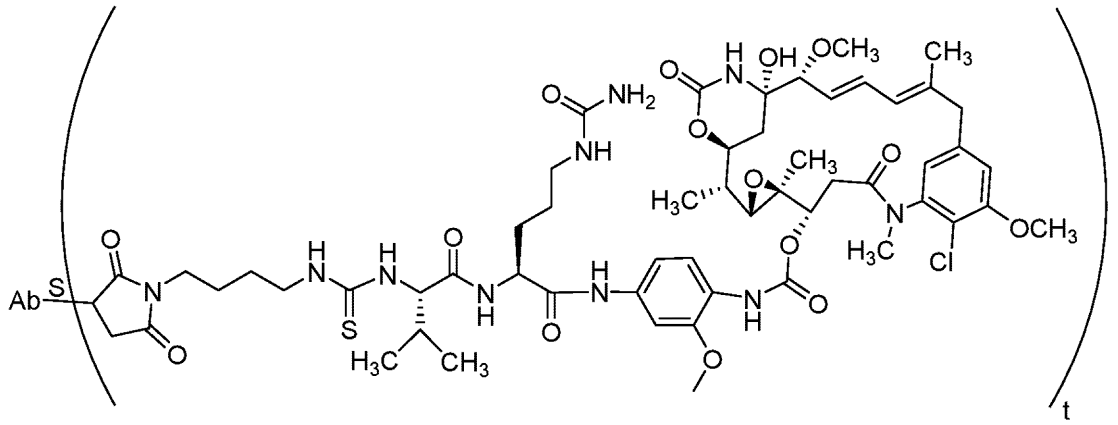


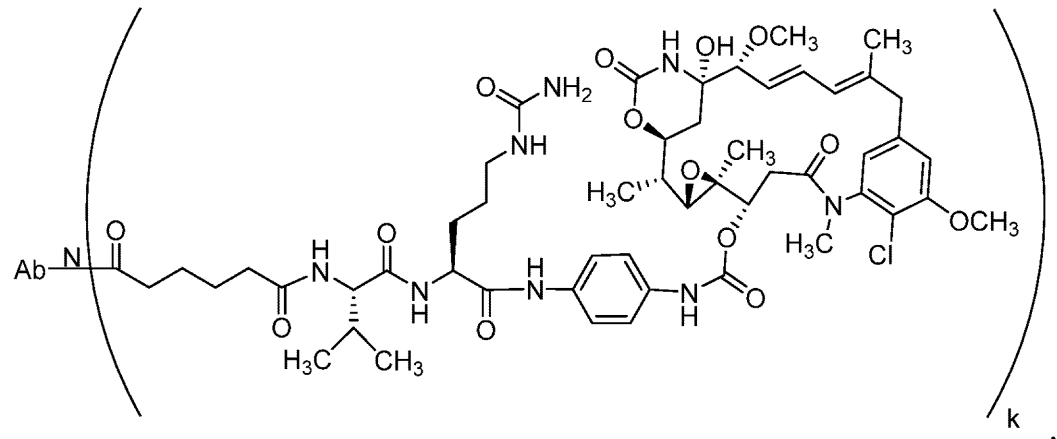
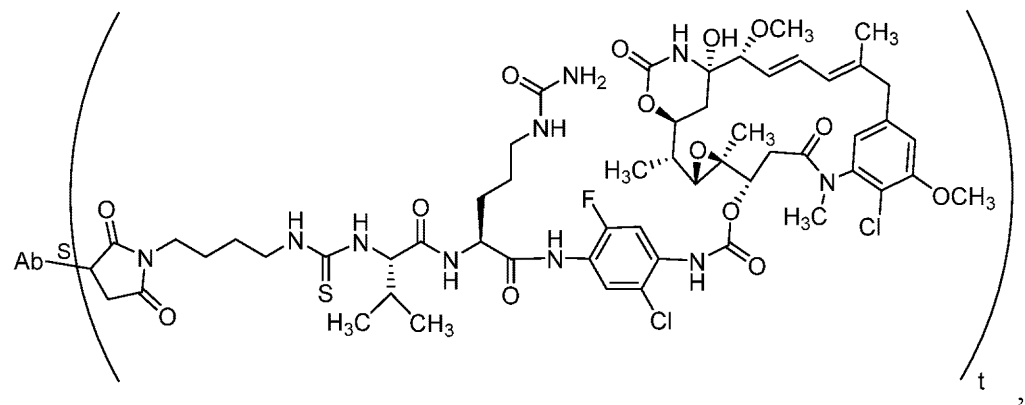
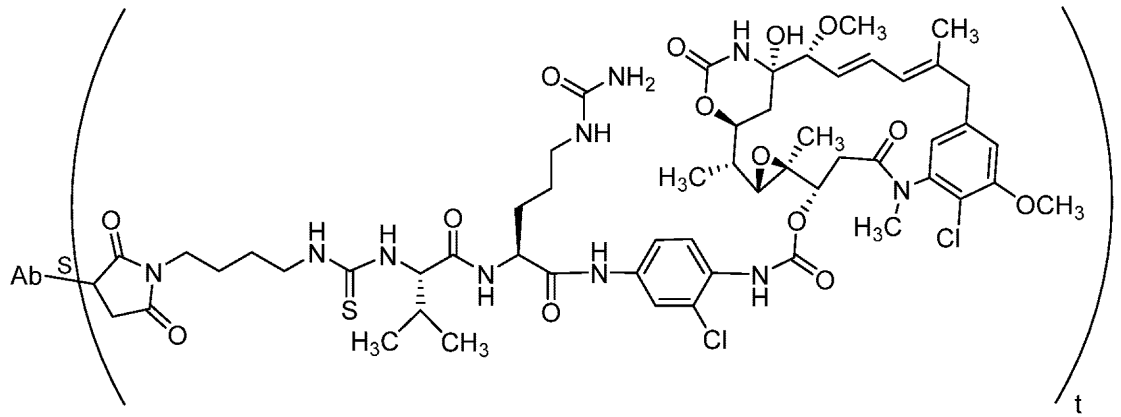


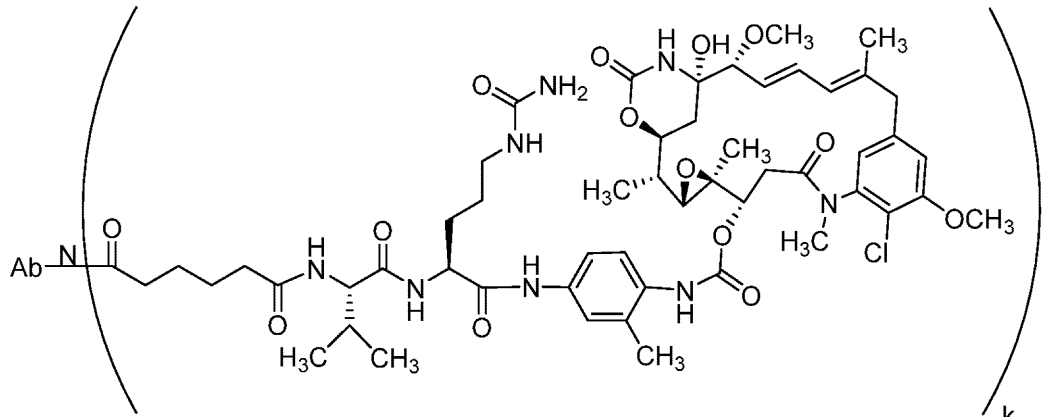




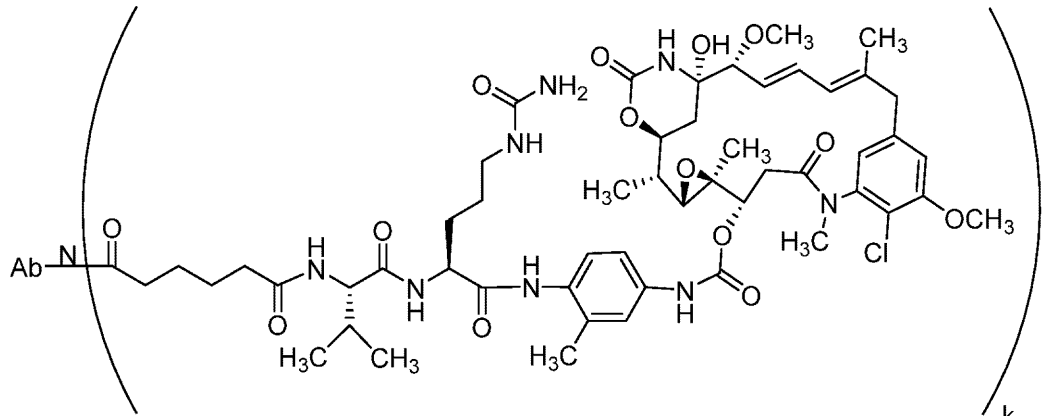




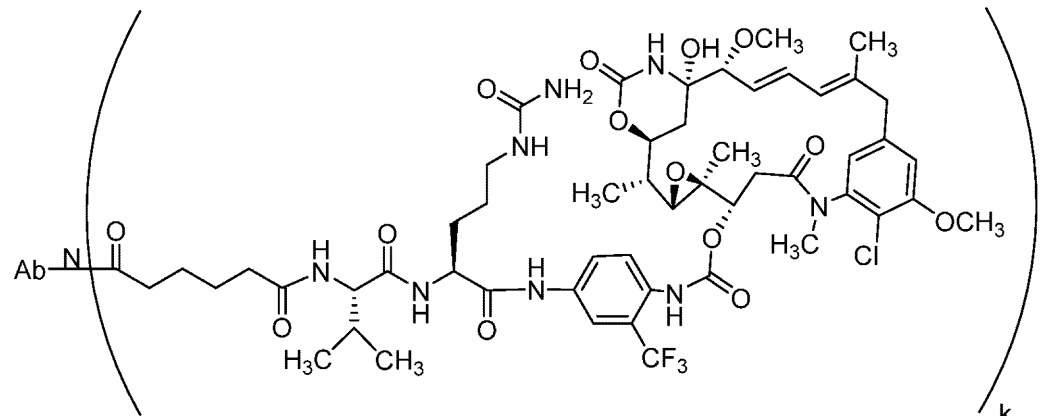




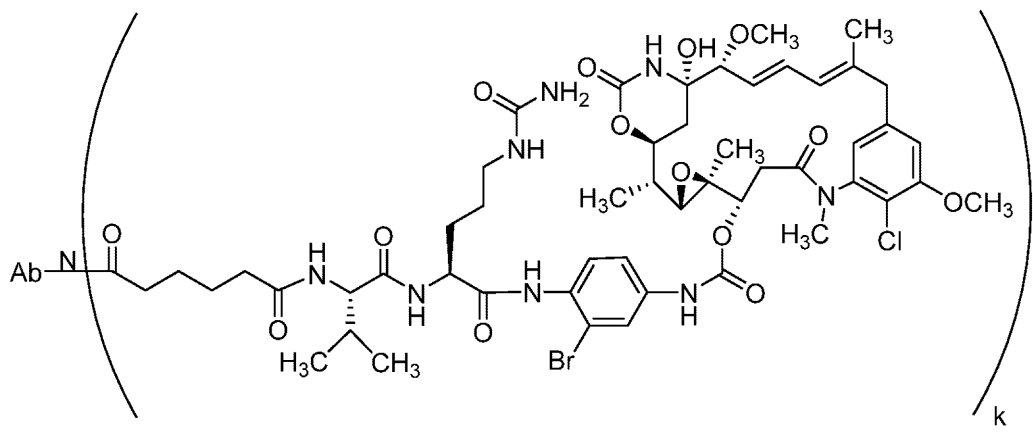
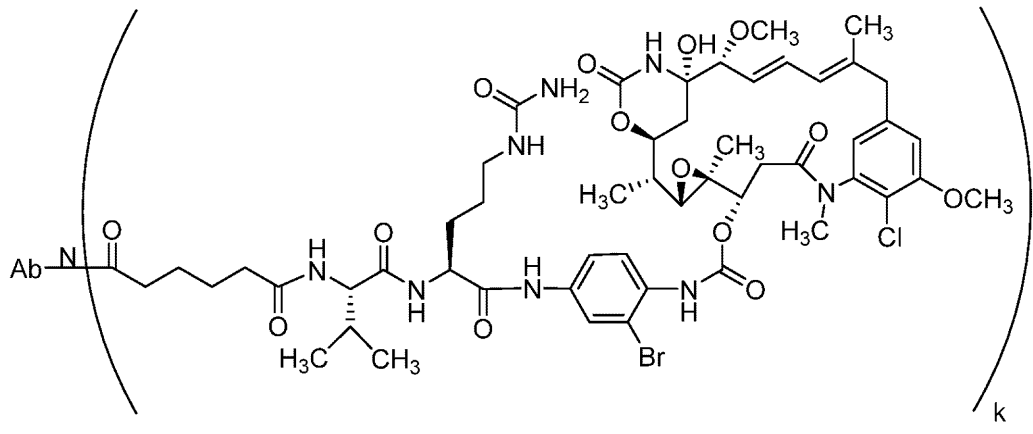
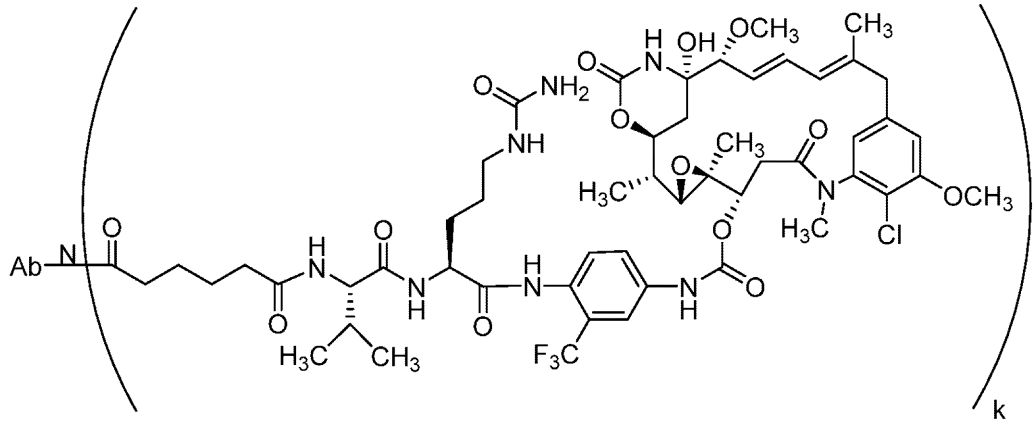
k,

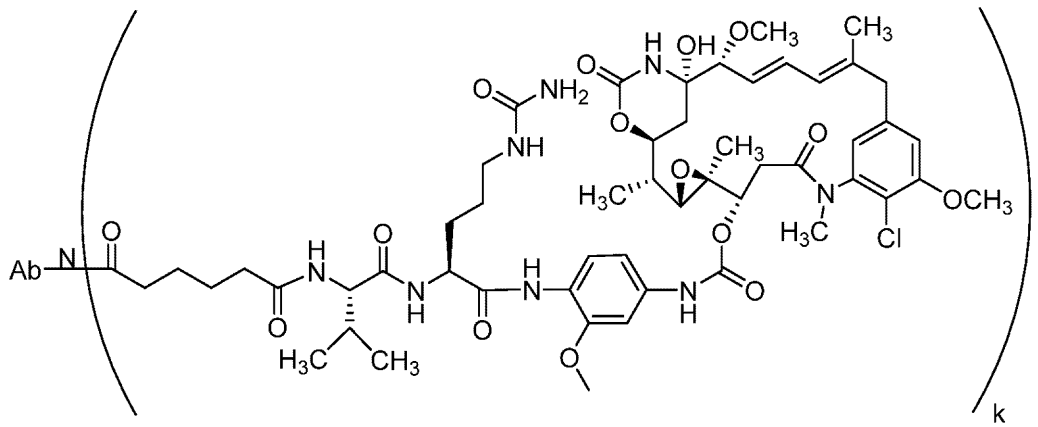
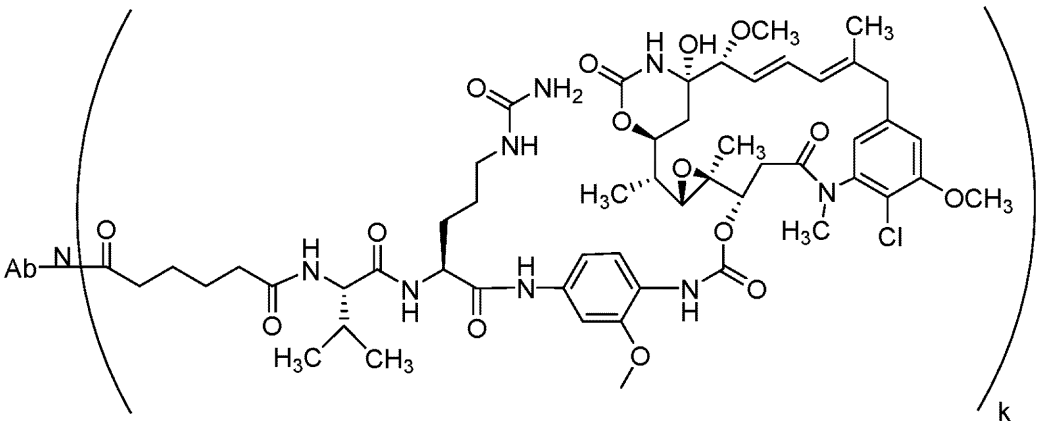
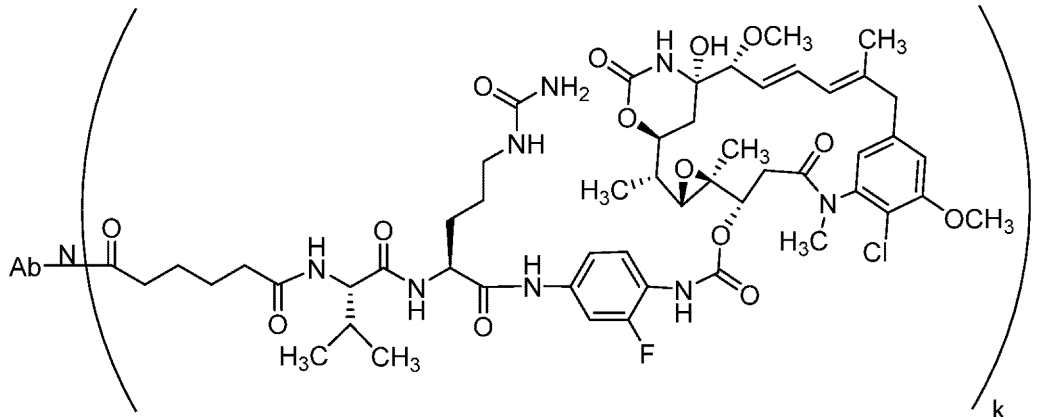


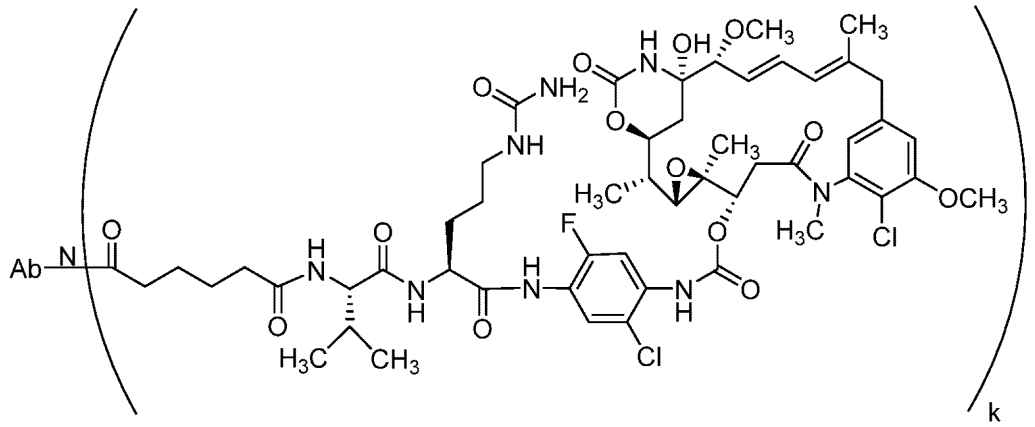
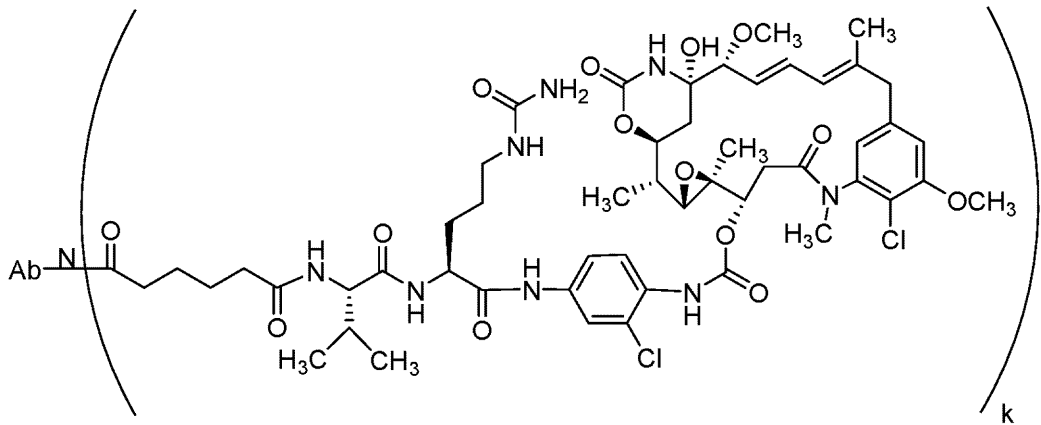
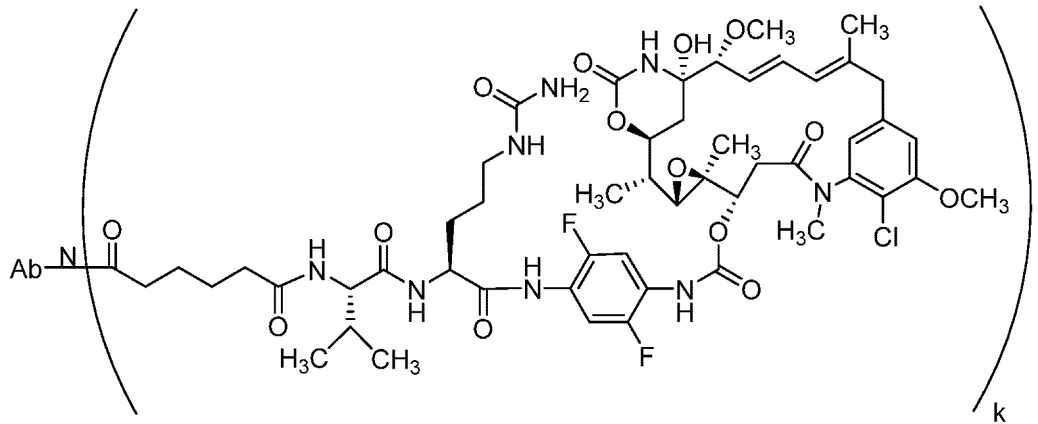
k,

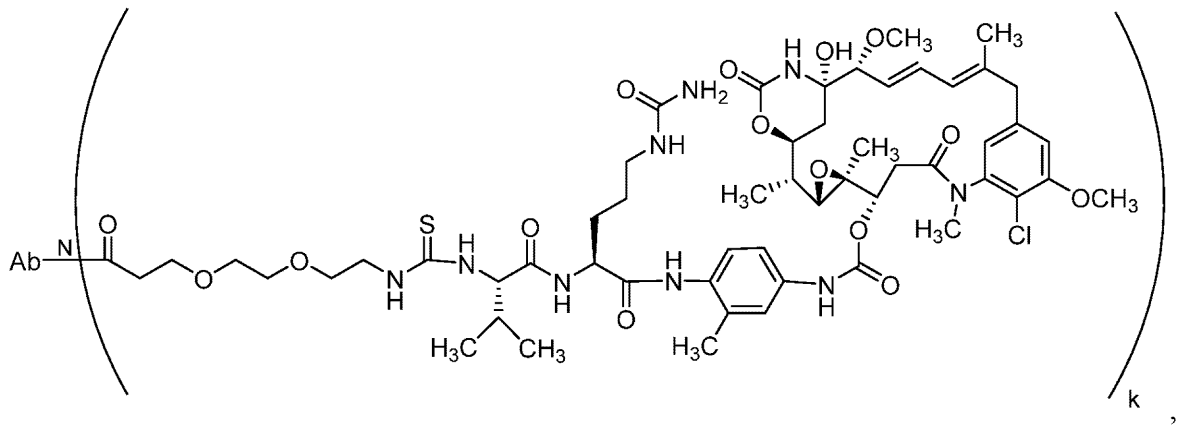
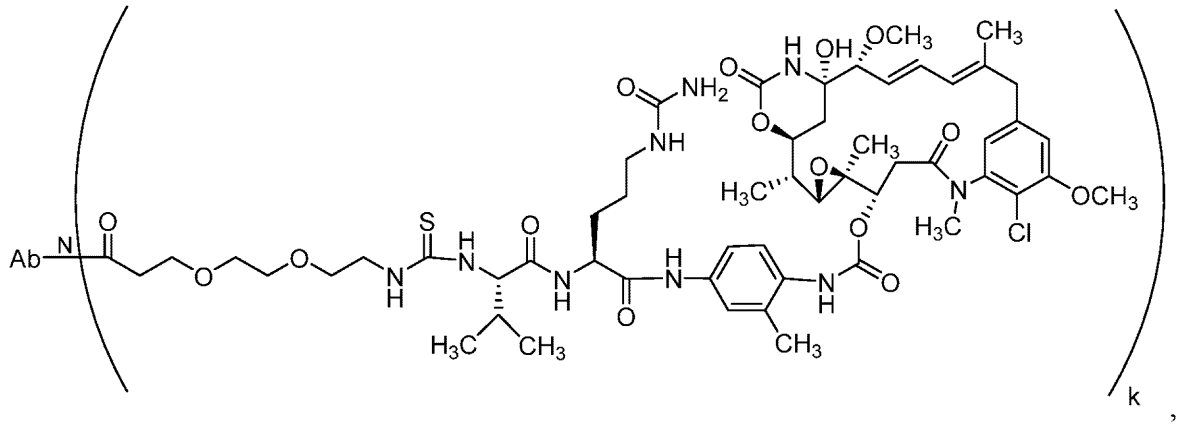
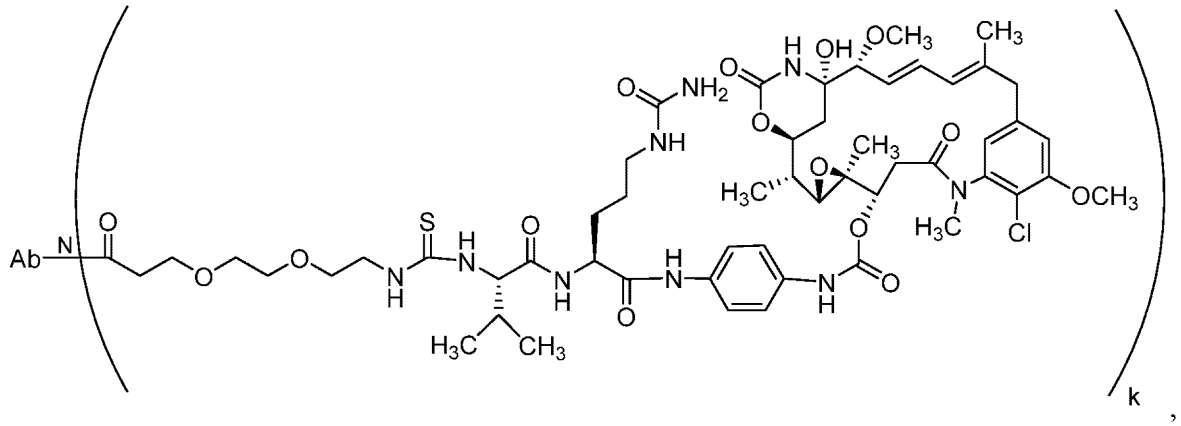


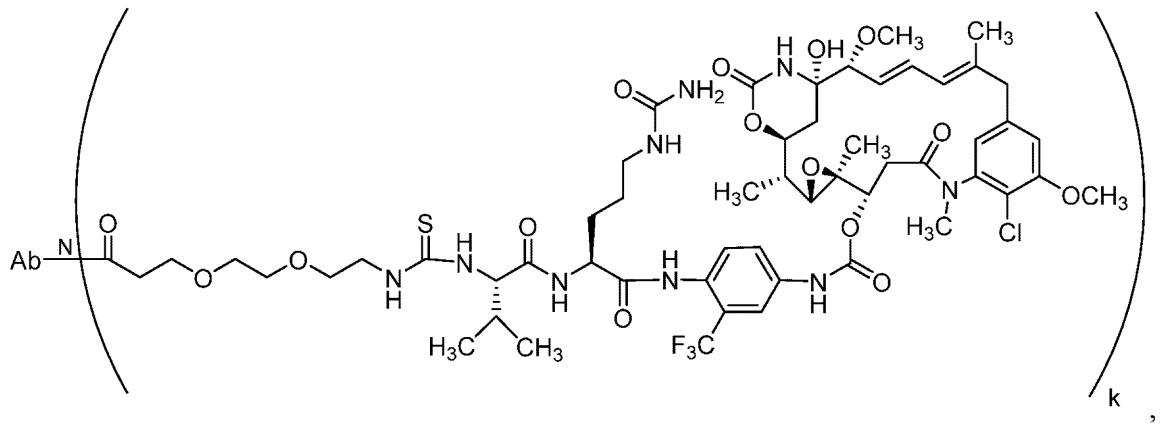
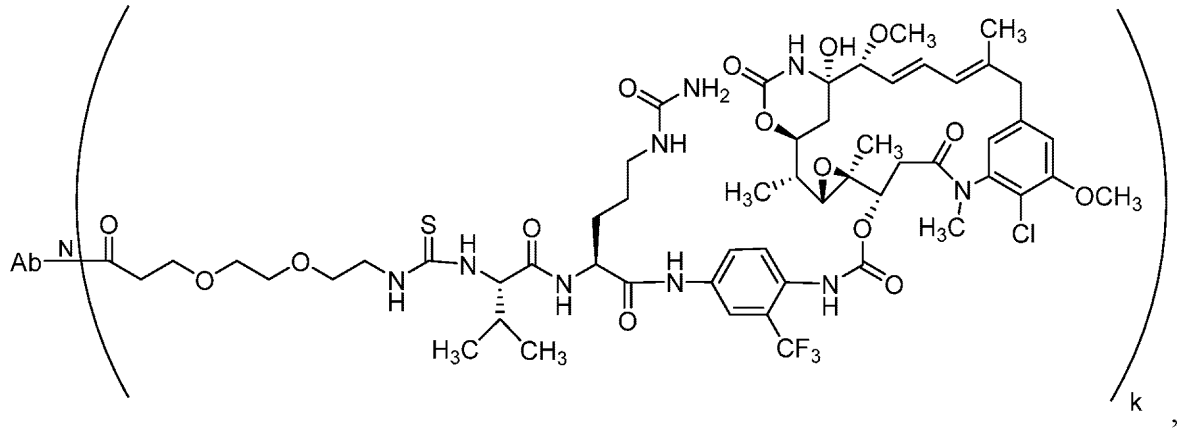
k,

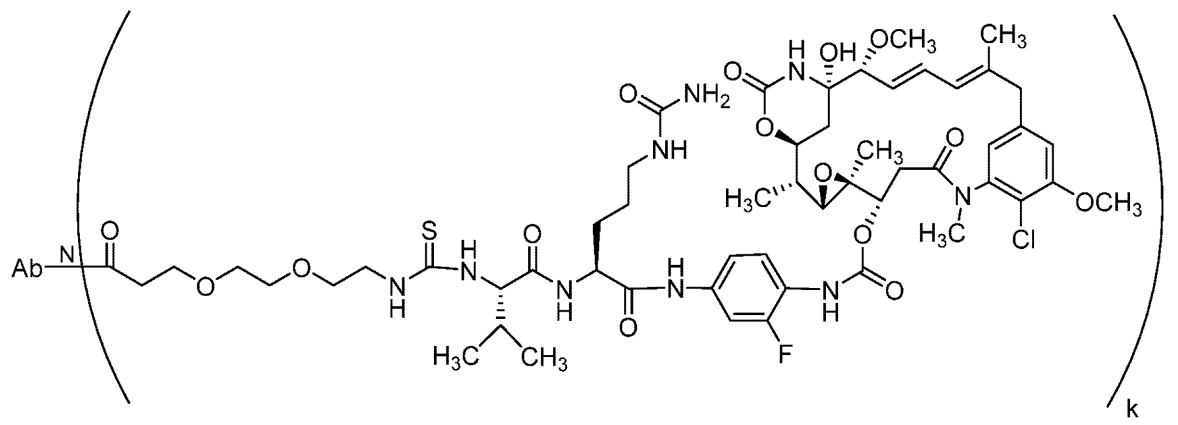
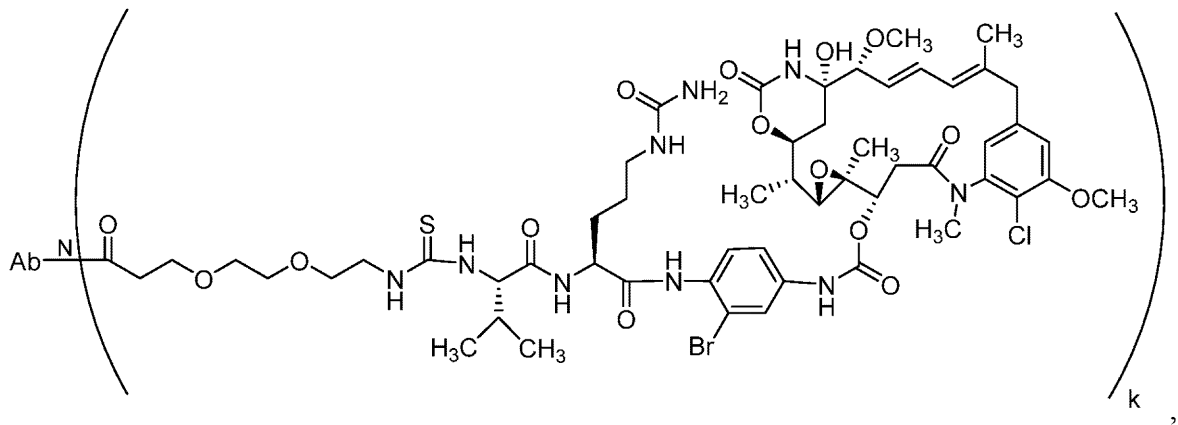
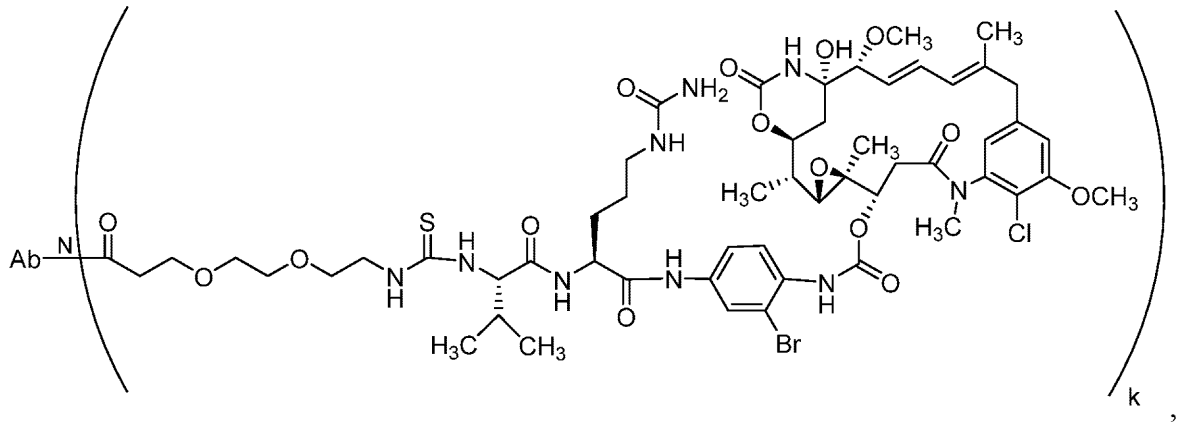


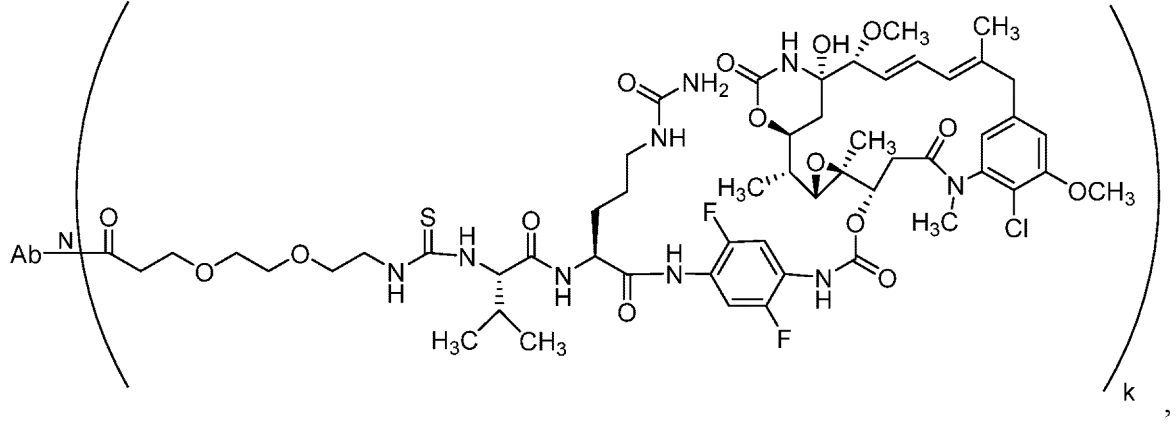
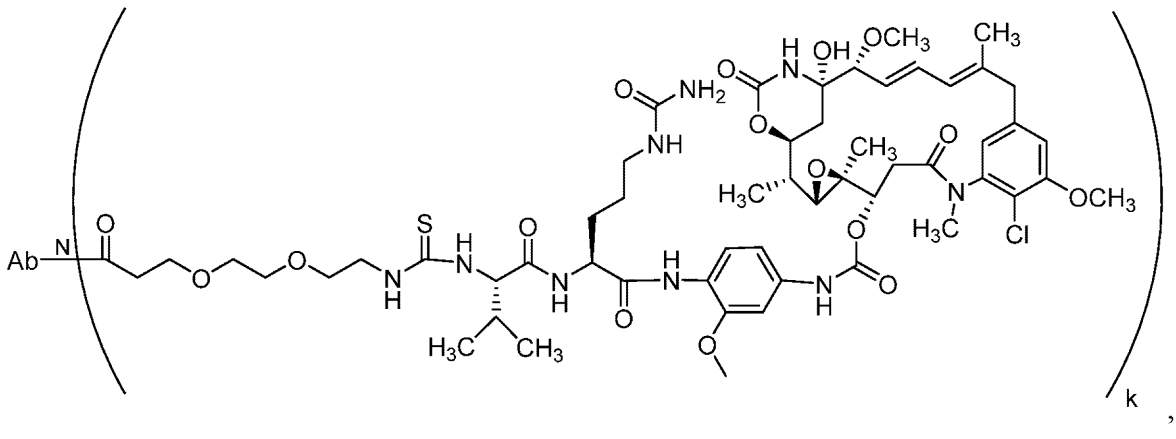
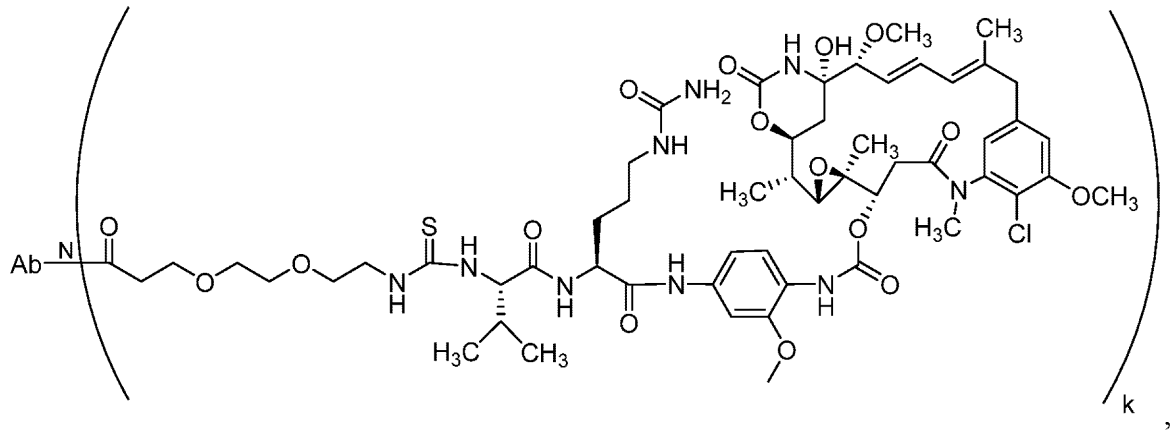


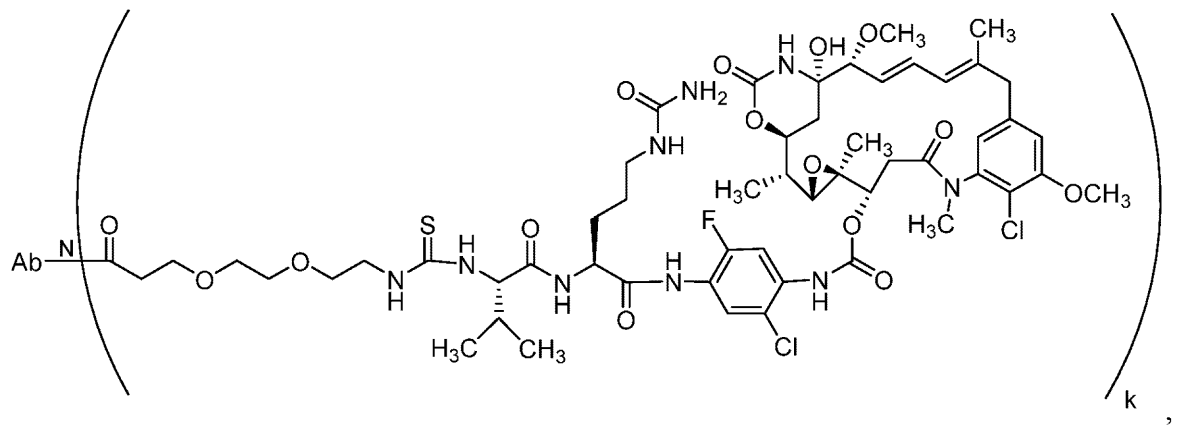
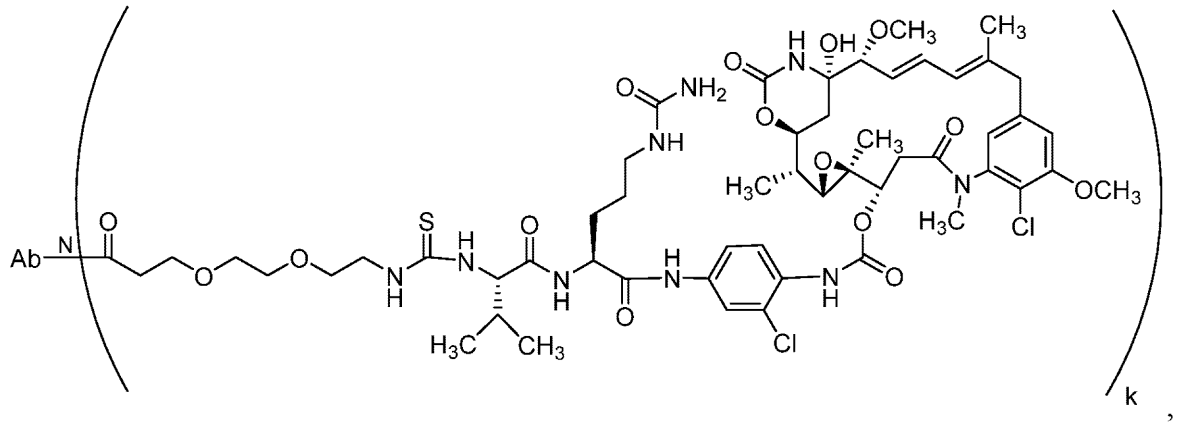


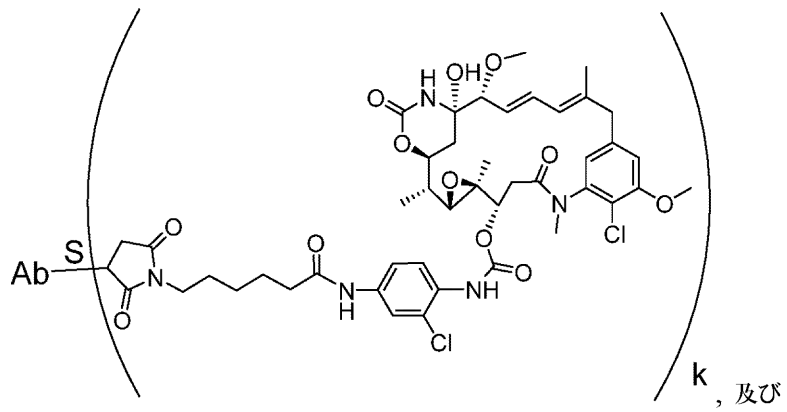
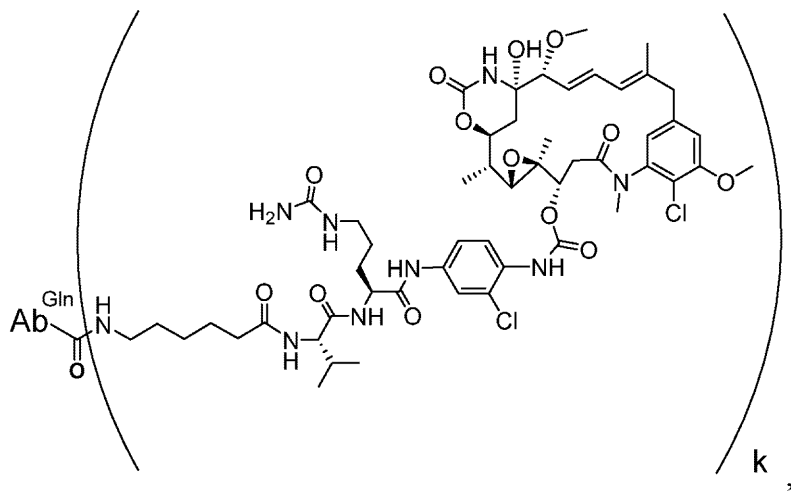
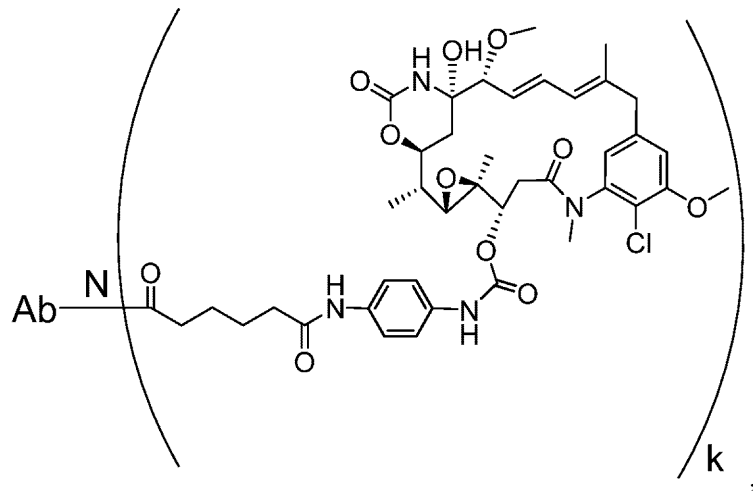


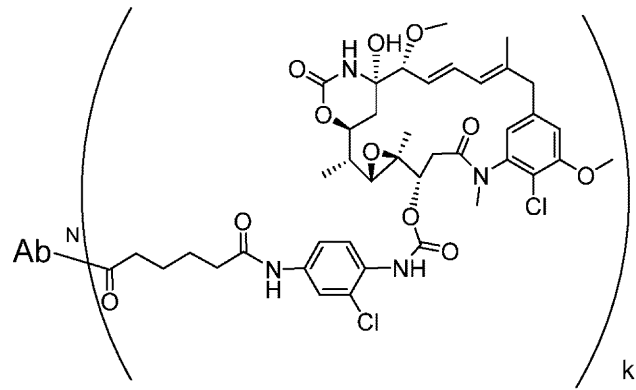












から選択され；

ここで；

Abが抗体であり；

(化34)

S

が該抗体のシステインとの結合であり；

(化35)

N

が該抗体のリジンとの結合であり；

kが1~30の整数であり；かつ

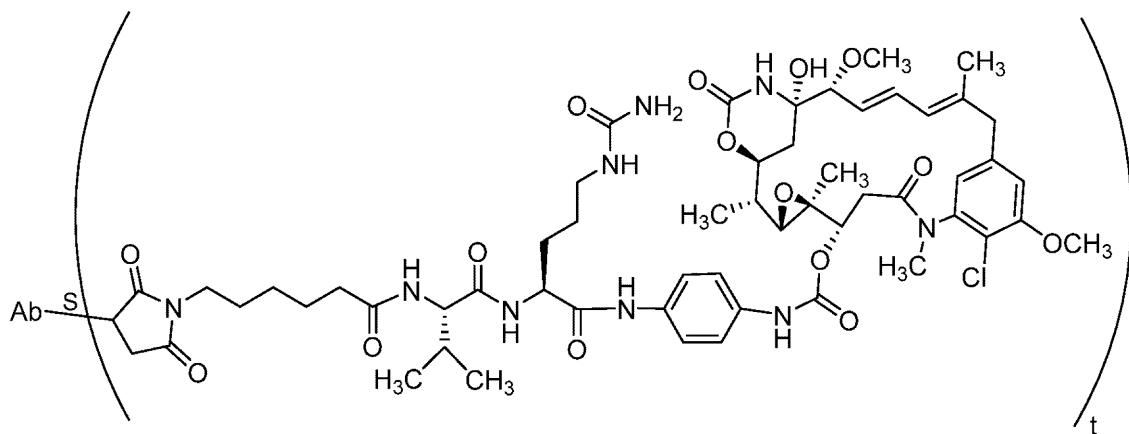
tが1~8の整数である、

構成1記載の化合物。

(構成26)

前記化合物が；

(化36)



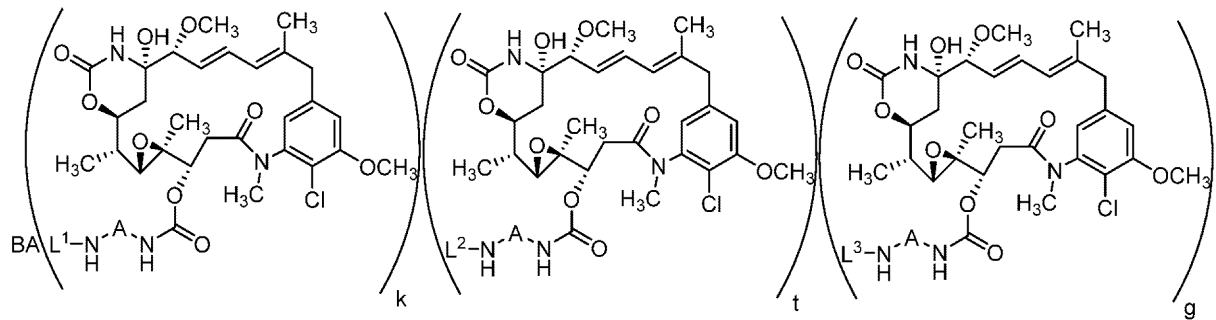
であり；かつ

Abが抗体又はその抗原結合断片である、
構成25記載の化合物。

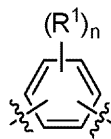
(構成27)

前記化合物が、以下の式；

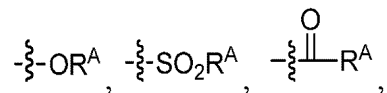
(化37)



を有し、
 ここで：
 Aが：
 (化38)



であり；
 R¹が、出現する毎に独立に、アルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシ、アリー
 ル、アルカリール、アリーラルキル、ハロ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ヘテロア
 ルキル、ヘテロアリール、ヘテロシクロアルキル、シアノ、ニトロ、
 (化39)



及びアジドから選択され；
 R^Aがアルキルであり；
 nが0~4の整数であり；
 L¹、L²、及びL³がリンカーであり、
 ここで：
 L¹はBA上のリジン残基に結合しており、
 L²はBA上のシステイン残基に結合しており、
 L³はBA上のグルタミン残基に結合しており、
 BAは結合剤であり、
 kは0~30の整数であり、
 tは0~8の整数であり、かつ
 gは0~4の整数である、
 構成1~24のいずれか一項記載の化合物。

(構成28)

k又はtが1である、構成1又は25~27のいずれか一項記載の化合物。

(構成29)

前記BAが抗体である、構成1~24又は27のいずれか一項記載の化合物。

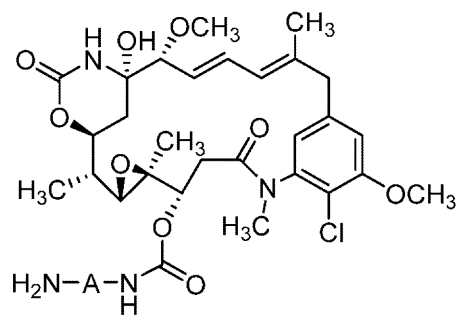
(構成30)

前記抗体が、抗MUC16抗体、抗PSMA抗体、抗STEAP2抗体、又は抗HER2抗体である、構成1
 ~24、26、28、又は29のいずれか一項記載の化合物。

(構成31)

式IIの化合物又はその医薬として許容し得る塩もしくは立体異性体：

(化40)



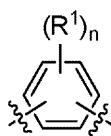
(II)

(式中、Aはアリーレン又はヘテロアリーレンである)。

(構成32)

Aが:

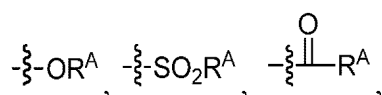
(化41)



であり;

R¹が、出現する毎に独立に、ハロ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、アルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシ、アリール、アルカリアル、アラルキル、ヘテロアリール、ヘテロシクロアルキル、シアノ、ニトロ、

(化42)



又はアジドであり;かつ

nが0~4の整数である、

構成31記載の化合物。

(構成33)

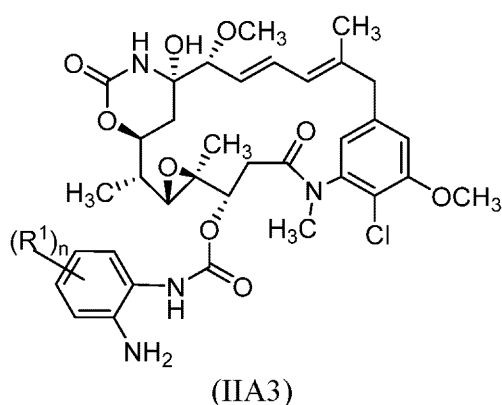
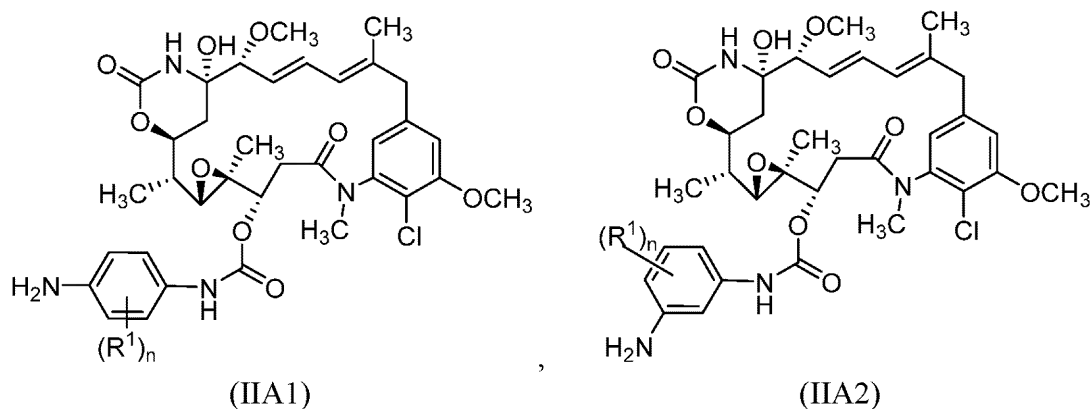
R¹が、出現する毎に独立に、アルキル、アルコキシ、ハロ、ハロアルキル、及びヘテロシクロアルキルから選択される、構成32記載の化合物。

(構成34)

前記式(II)の化合物が、式(IIA1)の化合物、式(IIA2)の化合物、及び式(IIA3)の化合物

:

(化43)



から選択される、構成31～33のいずれか一項記載の化合物。

(構成35)

n が0、1、2、又は3である、構成32～34のいずれか一項記載の化合物。

(構成36)

R^1 が、出現する毎に独立に、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、ハロ、 C_{1-6} ハロアルキル、及びヘテロシクロアルキルから選択される、構成32～35のいずれか一項記載の化合物。

(構成37)

R^1 が、出現する毎に独立に、メチル、メトキシ、フルオロ、クロロ、プロモ、トリフルオロメチル、ピロリジニル、及びモルホリニルから選択される、構成32～36のいずれか一項記載の化合物。

(構成38)

R^1 がメチルである、構成32～36のいずれか一項記載の化合物。

(構成39)

R^1 が、出現する毎に独立に、フルオロ、クロロ、及びプロモから選択される、構成32～36のいずれか一項記載の化合物。

(構成40)

R^1 がクロロである、構成32～36のいずれか一項記載の化合物。

(構成41)

R^1 がトリフルオロメチルである、構成32～36のいずれか一項記載の化合物。

(構成42)

R^1 がメトキシである、構成32～36のいずれか一項記載の化合物。

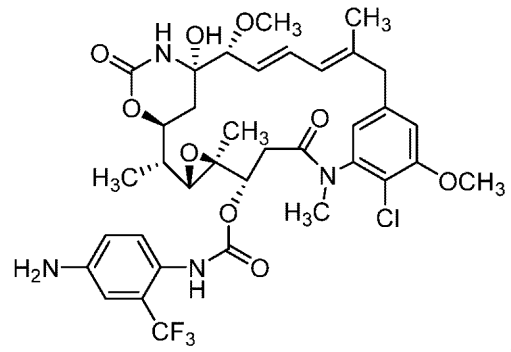
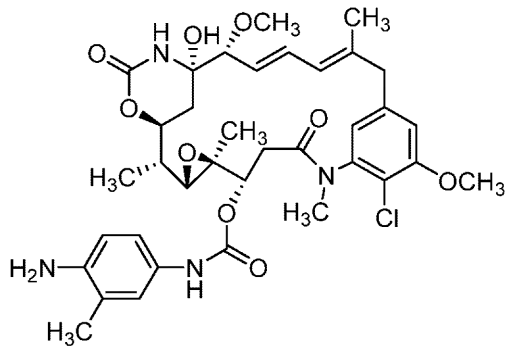
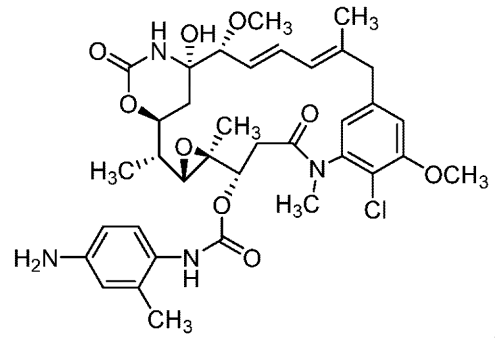
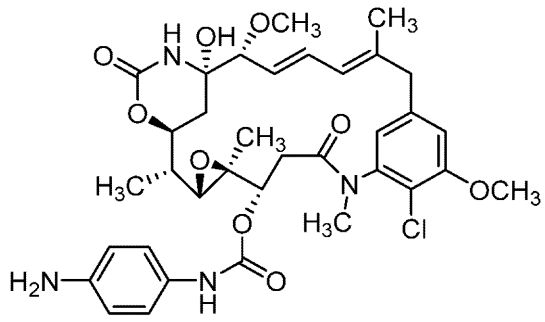
(構成43)

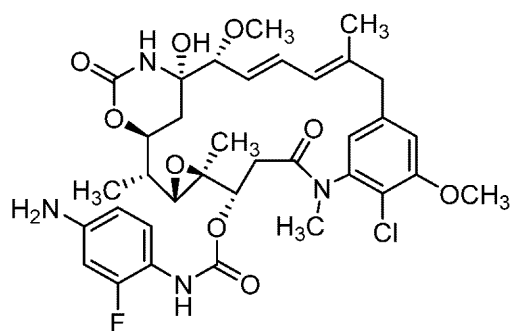
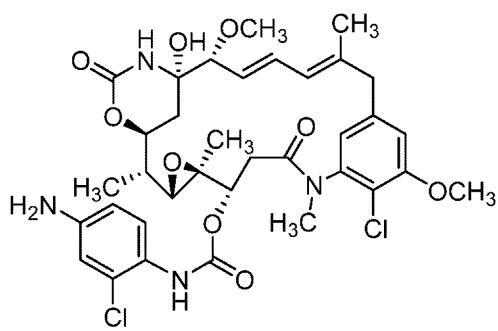
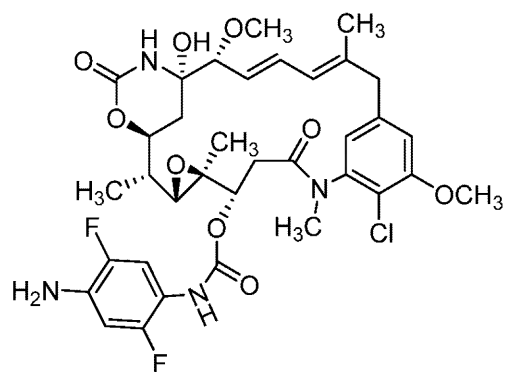
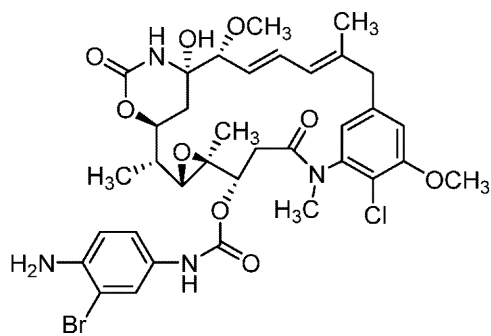
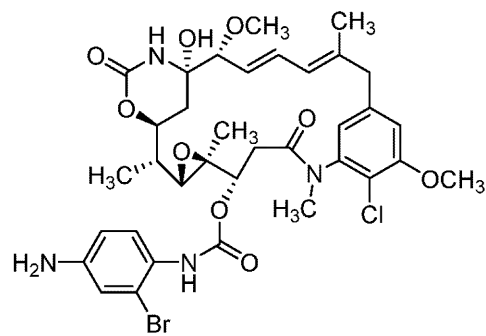
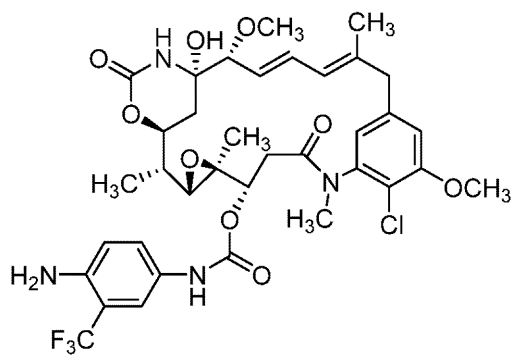
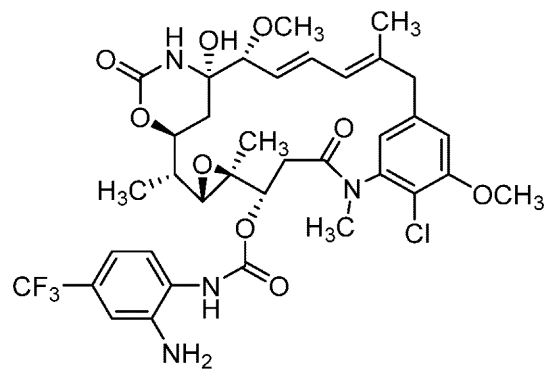
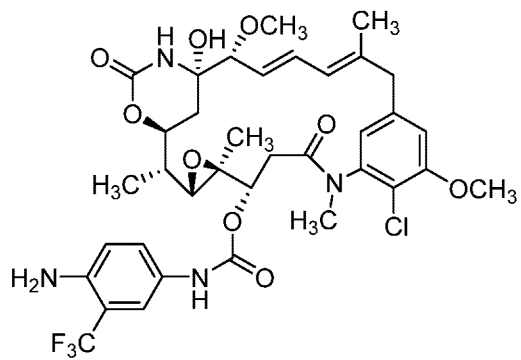
R^1 が、出現する毎に独立に、メチル、モルホリニル、及びピロリジニルから選択される、構成32～36のいずれか一項記載の化合物。

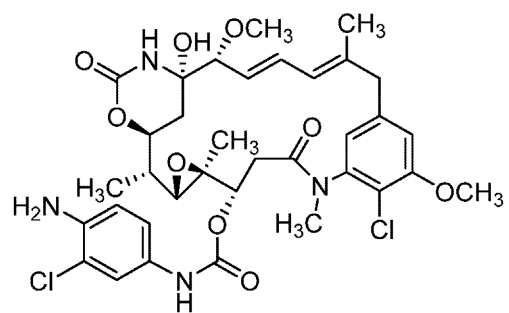
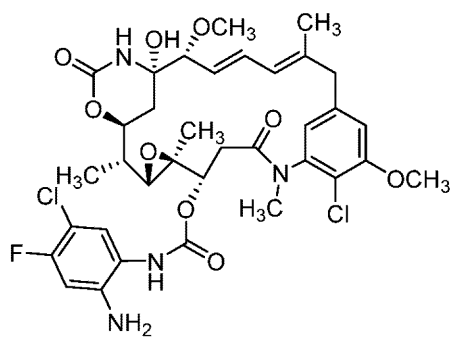
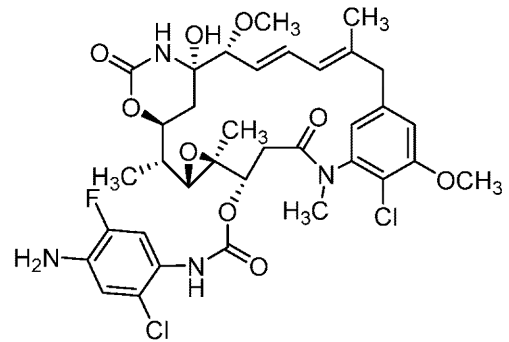
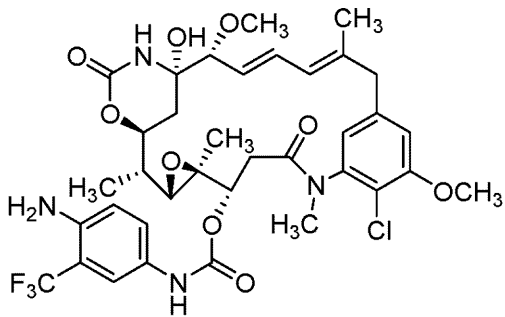
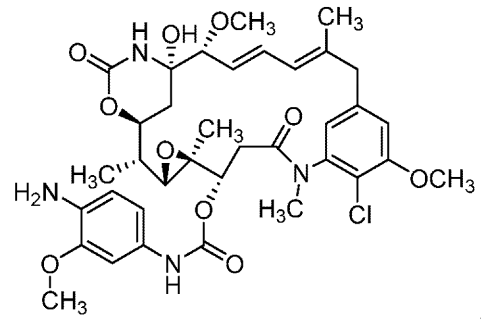
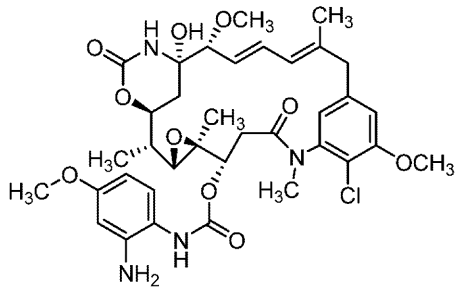
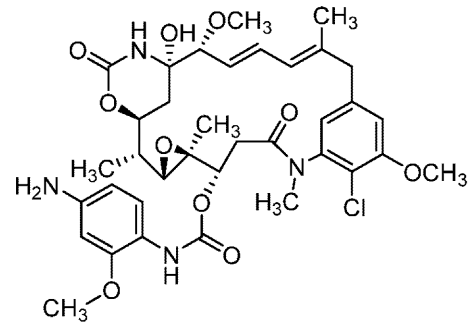
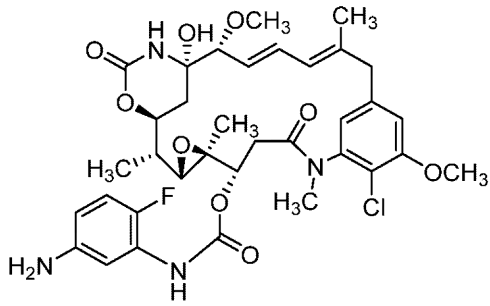
(構成44)

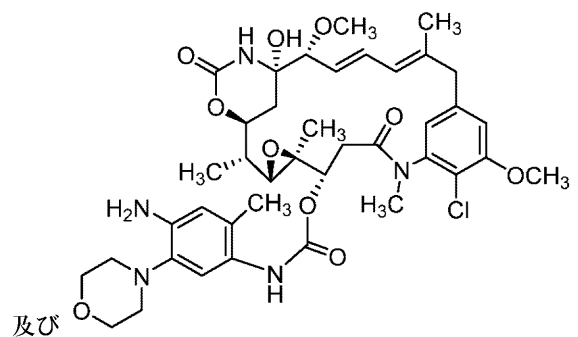
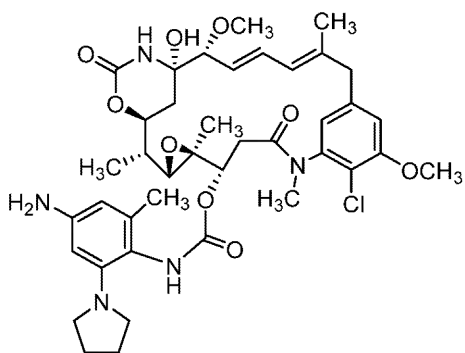
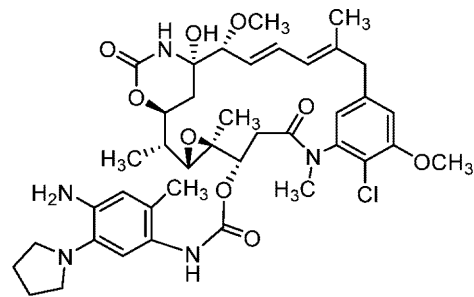
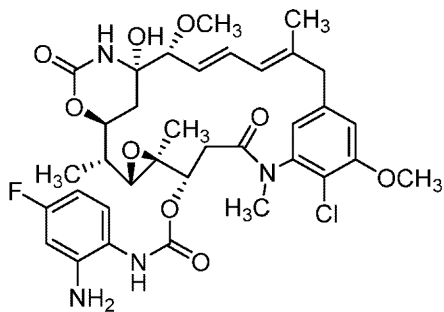
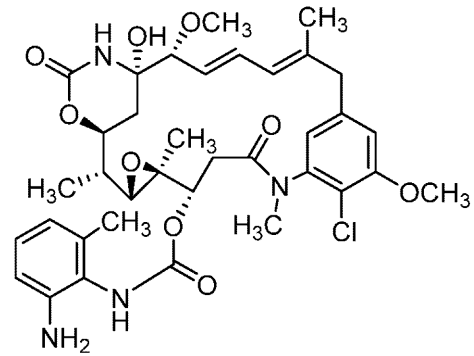
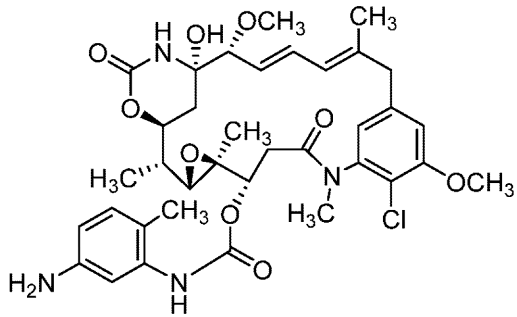
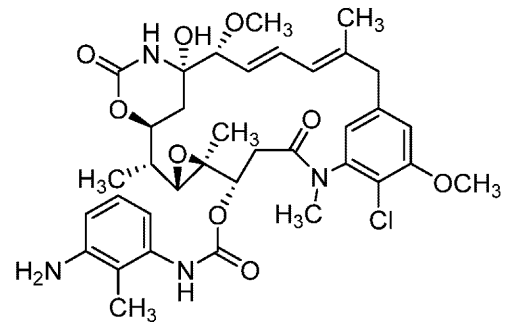
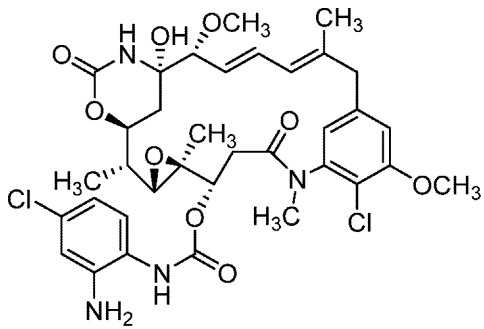
前記化合物が：

(化44)









から選択される、構成31記載の化合物。

(構成45)

構成1~44のいずれか一項記載の化合物及び医薬として許容し得る賦形剤を含む医薬組成物。

(構成46)

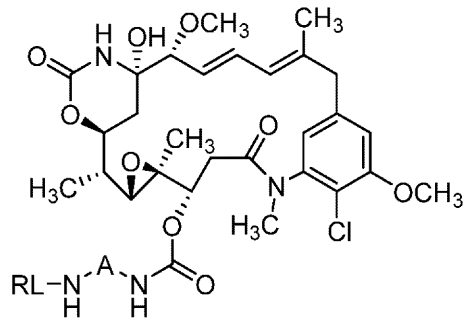
増殖性障害を治療する方法であって、該障害を有する患者に、構成1~44のいずれか一項記載の化合物又は構成45記載の組成物の治療有効量を投与することを、前記方法。

(構成47)

及び

式P1の化合物:

(化45)



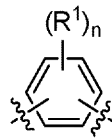
(P1)

(式中、Aはアリーレン又はヘテロアリーレンであり;かつRLは反応性リンカーである)。

(構成48)

Aが:

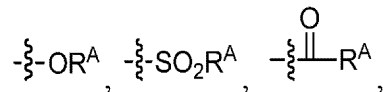
(化46)



であり;

R¹が、出現する毎に独立に、アルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシ、アリー
ル、アルカール、アリールアルキル、ハロ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ヘテロア
ルキル、ヘテロアリール、ヘテロシクロアルキル、シアノ、ニトロ、

(化47)



及びアジドから選択され;

R^Aがアルキルであり;かつ

nが0~4の整数である、

構成47記載の化合物。

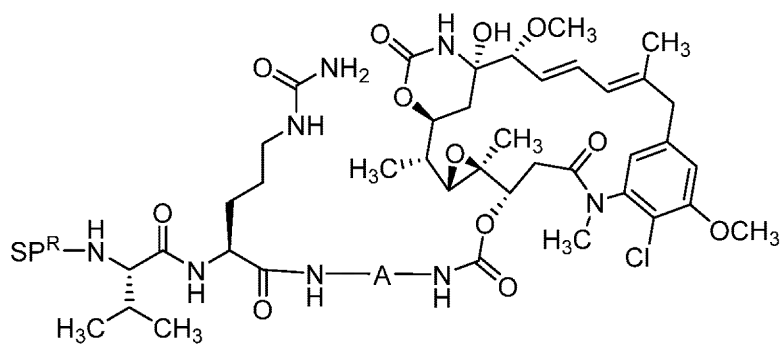
(構成49)

R¹が、出現する毎に独立に、アルキル、アルコキシ、ハロ、ハロアルキル、及びヘテロ
シクロアルキルから選択される、構成48記載の化合物。

(構成50)

前記式P1の化合物が、式P2A1-3の化合物:

(化48)



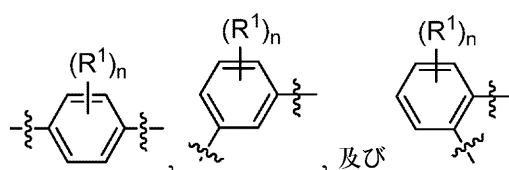
(P2A1-3)

であり、

式中：

Aが：

(化49)



から選択され、かつ

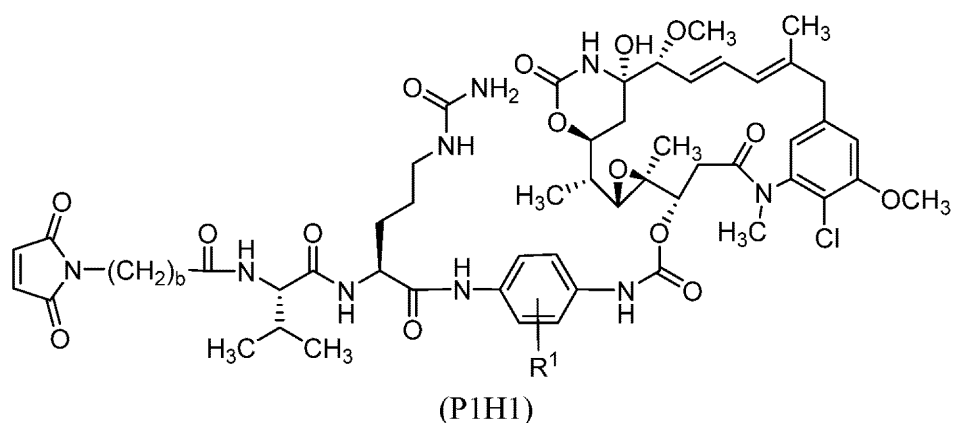
SP^R がスペーサー反応基である、

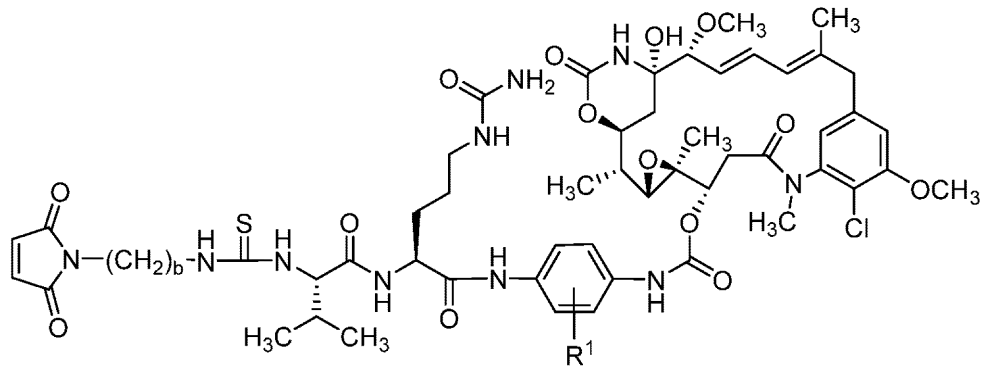
構成47～49のいずれか一項記載の化合物。

(構成51)

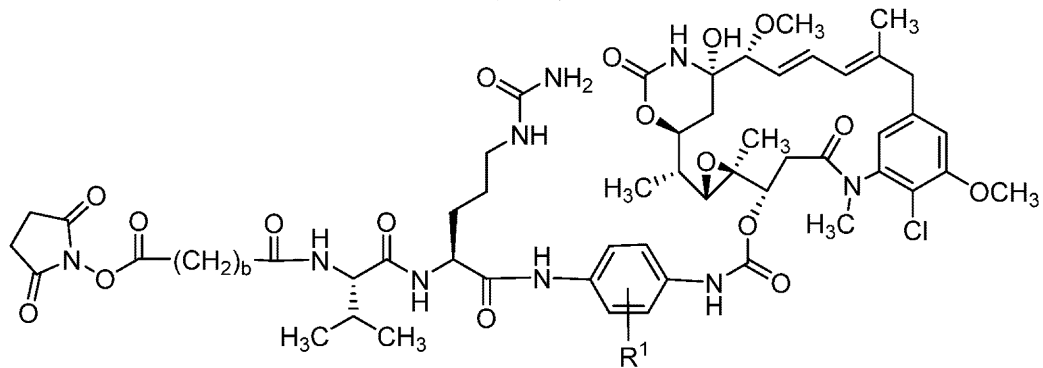
前記式P1の化合物が、式P1H1の化合物、式P1I1の化合物、式P1V1の化合物、式P1W1の化合物、式P1K1の化合物、式P1TG1の化合物、式P1ZZ1の化合物、及び式P1ZZ2の化合物：

(化50)

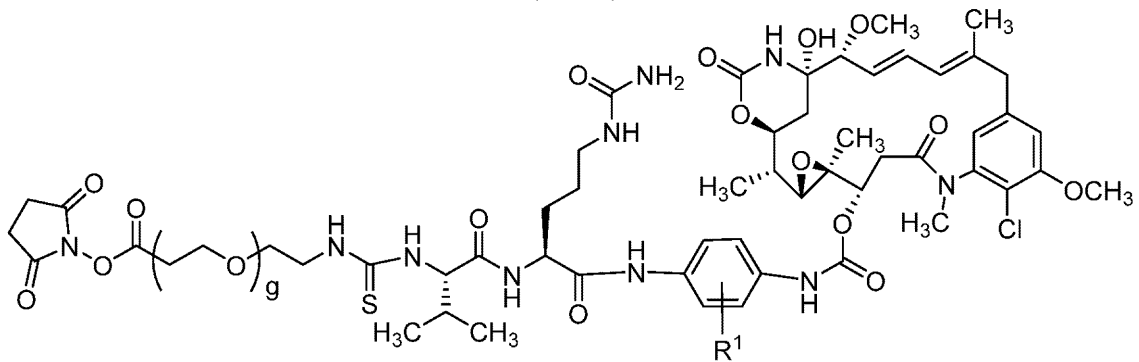




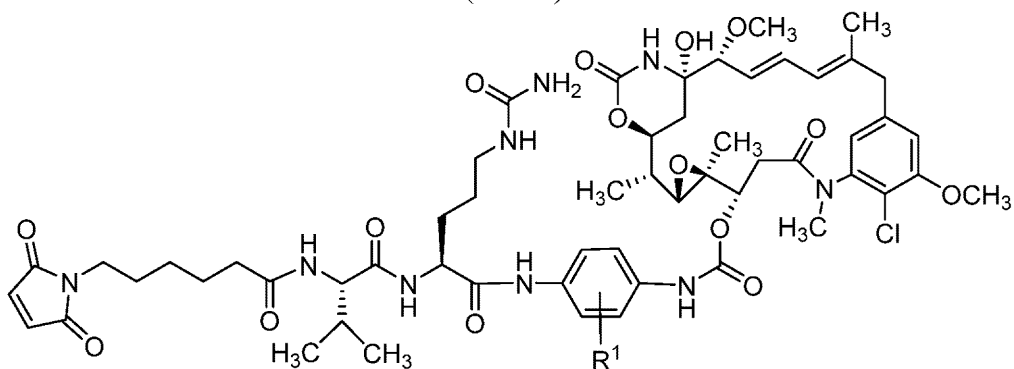
(P1I1)



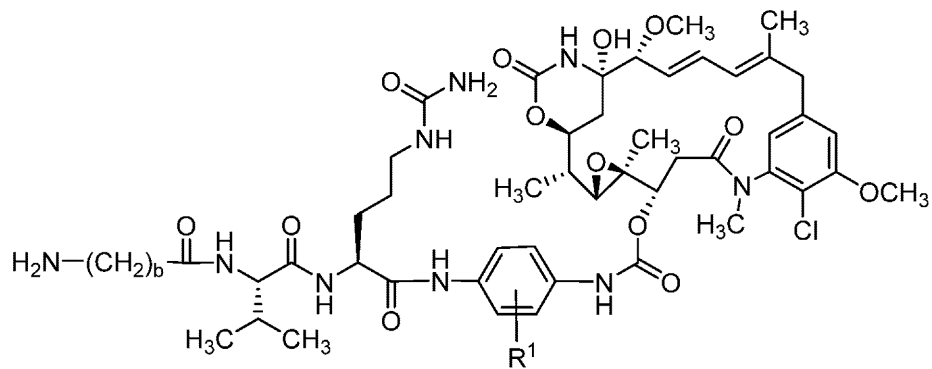
(P1V1)



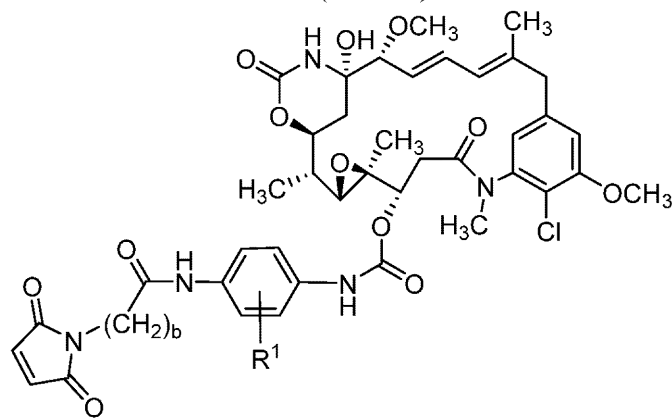
(P1W1)



(P1K1)

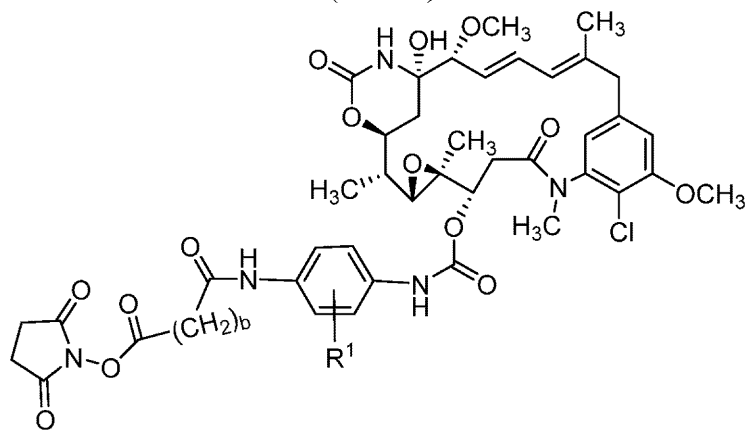


(PITG1)



(P1ZZ1)

, 及び



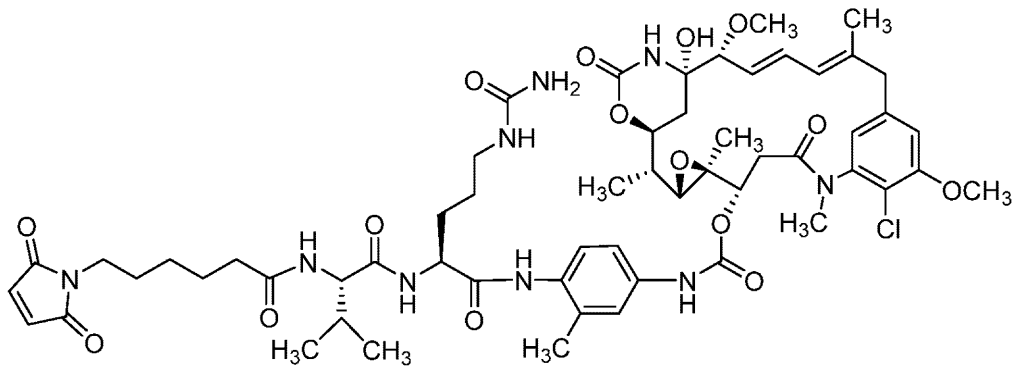
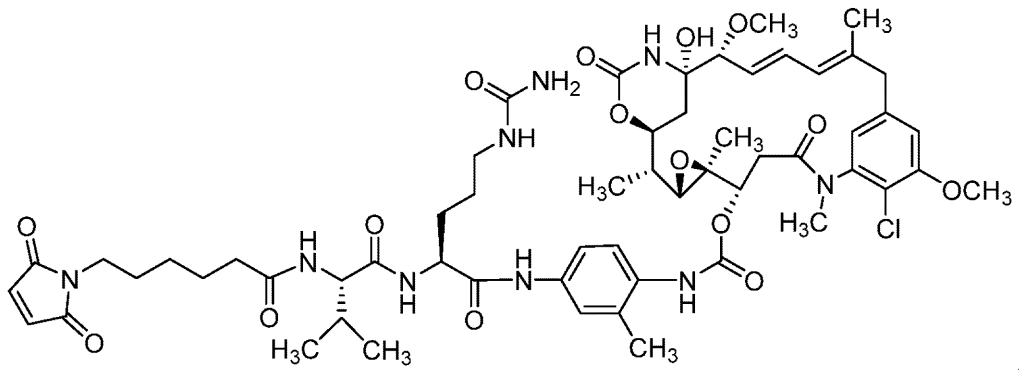
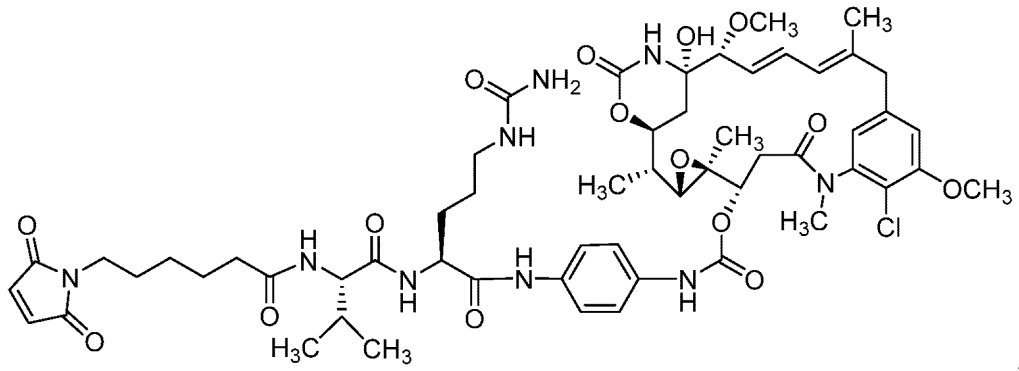
(P1ZZ2)

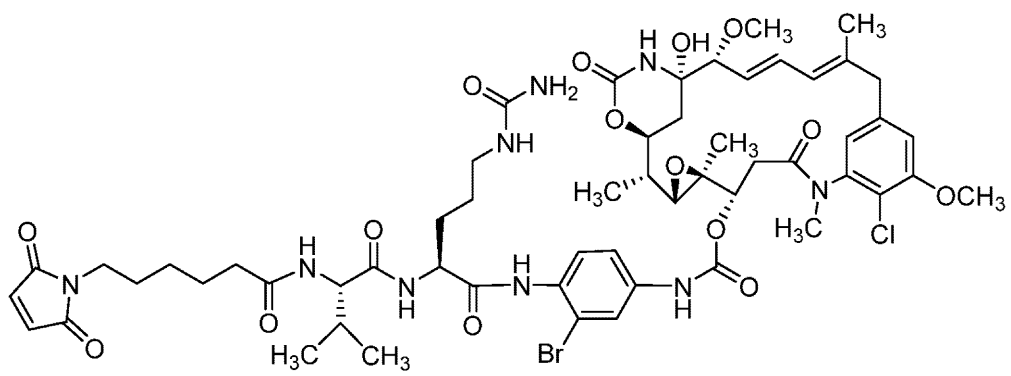
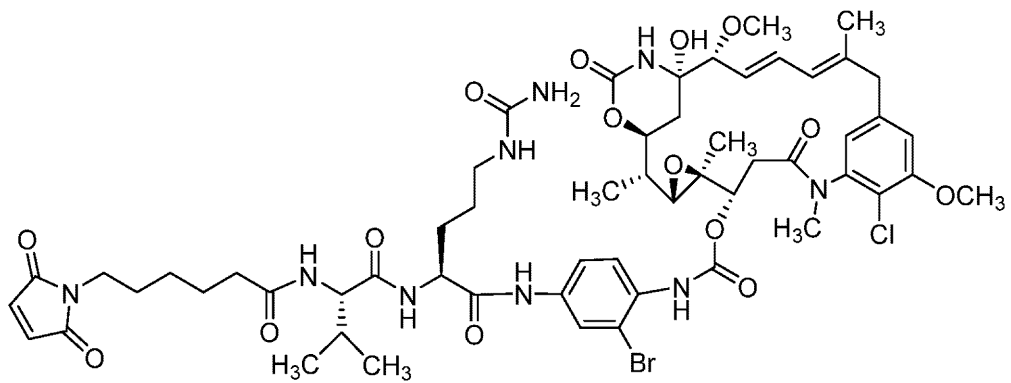
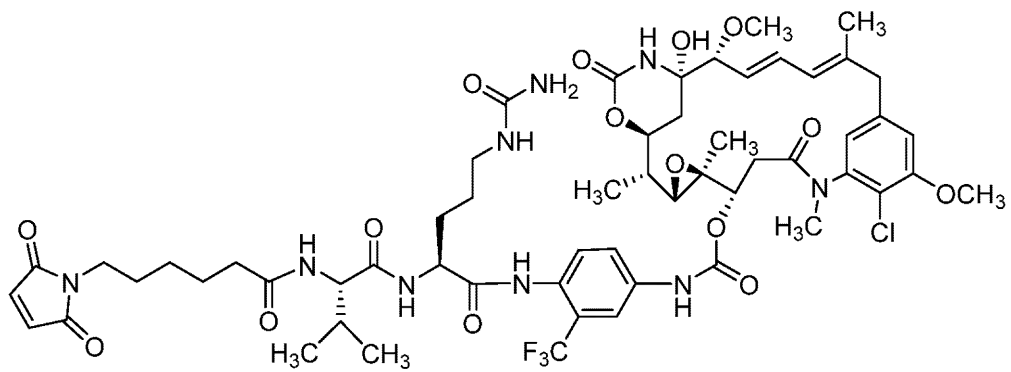
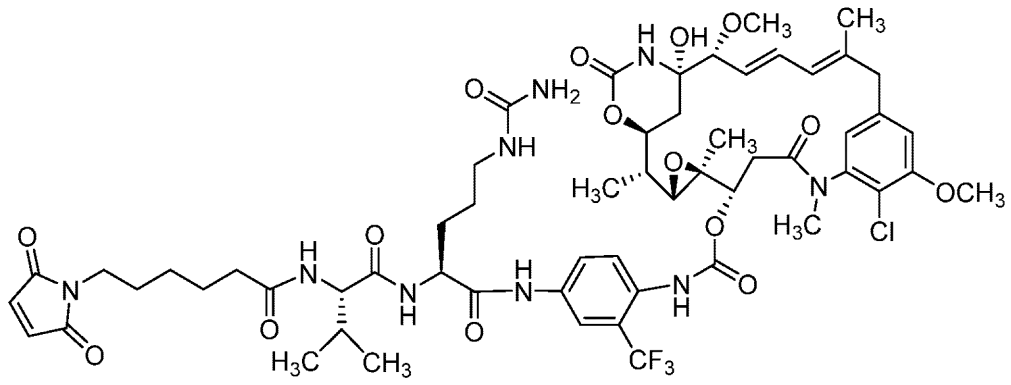
から選択される、構成47～49記載の化合物。

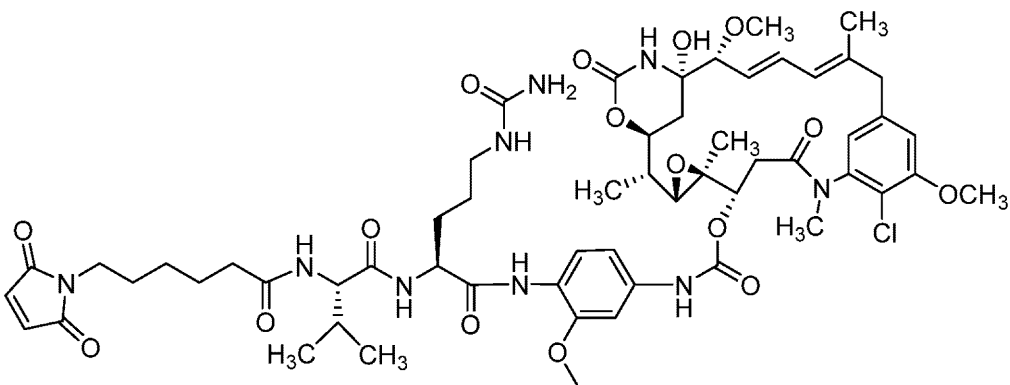
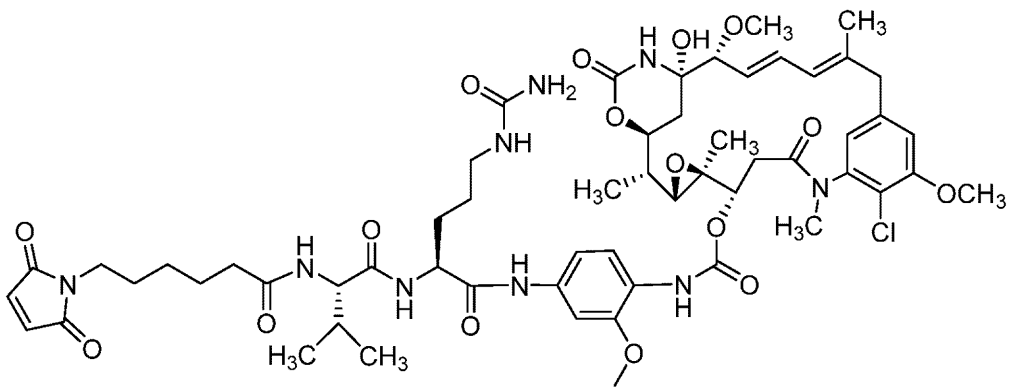
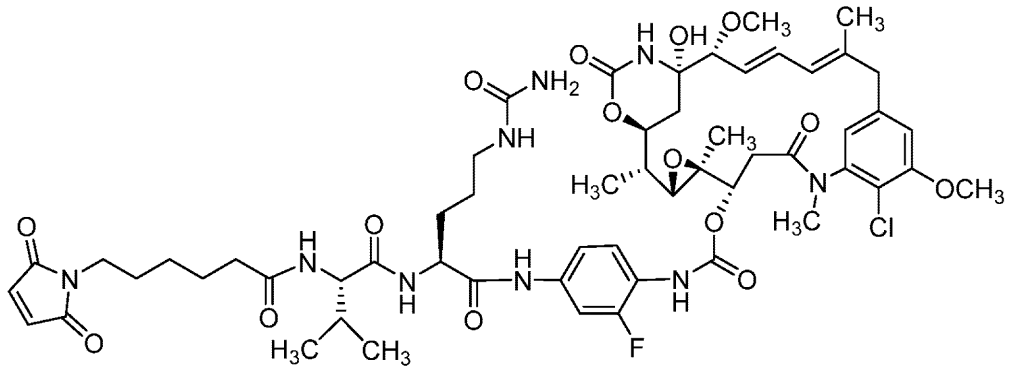
(構成52)

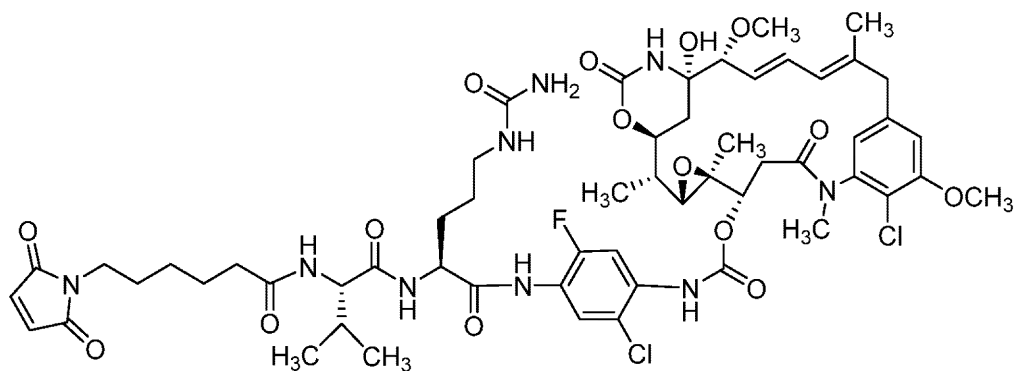
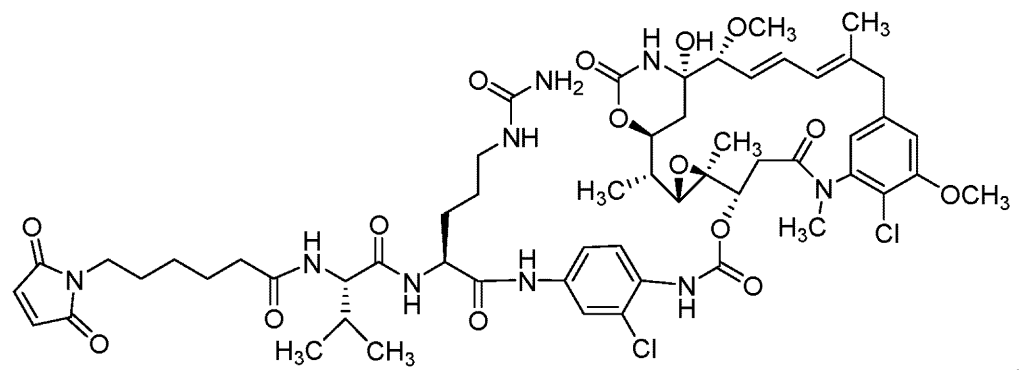
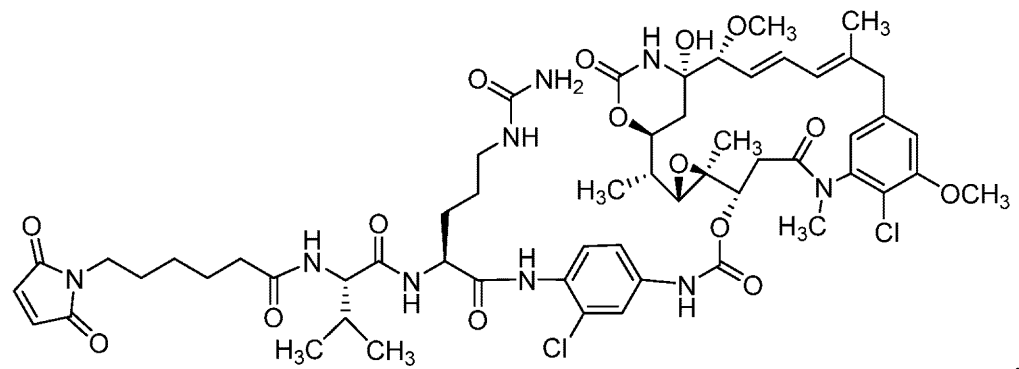
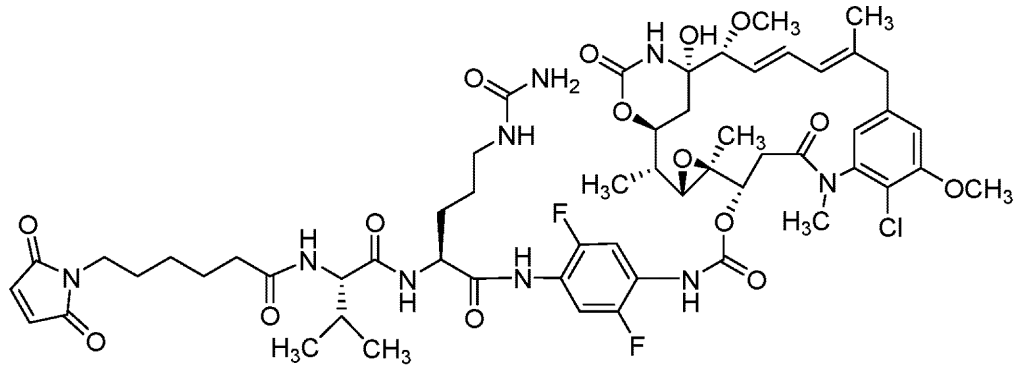
前記化合物が：

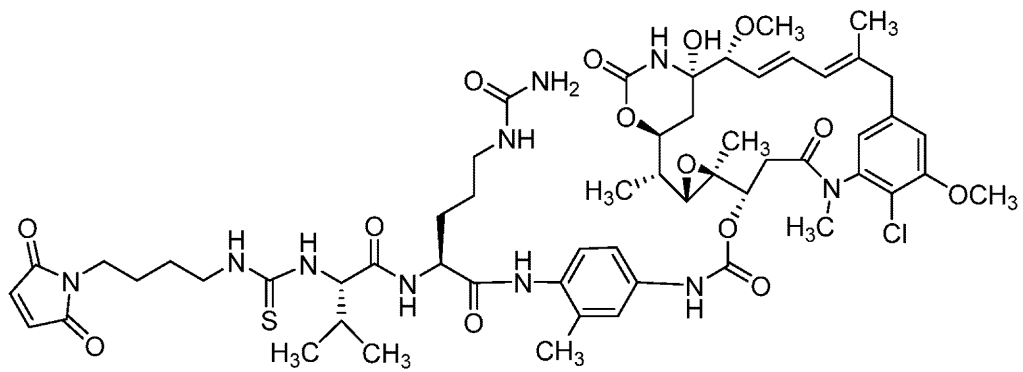
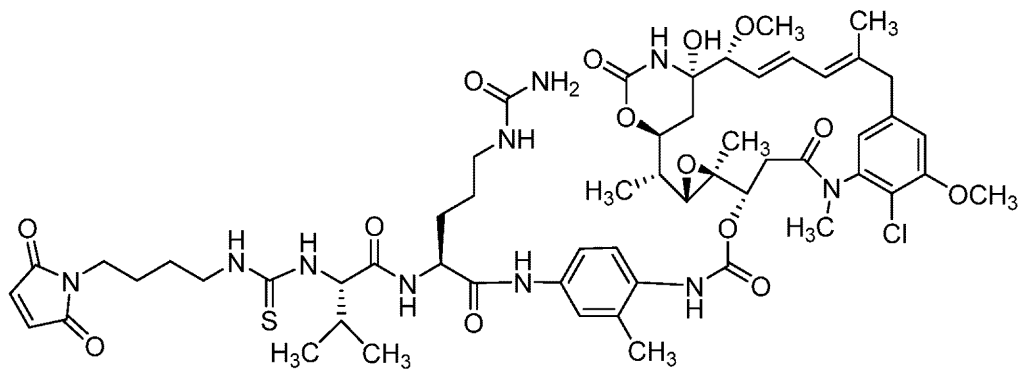
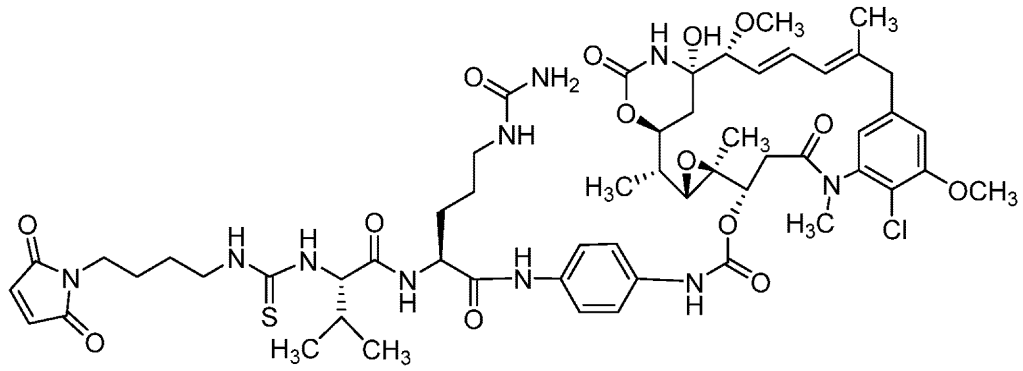
(化51)

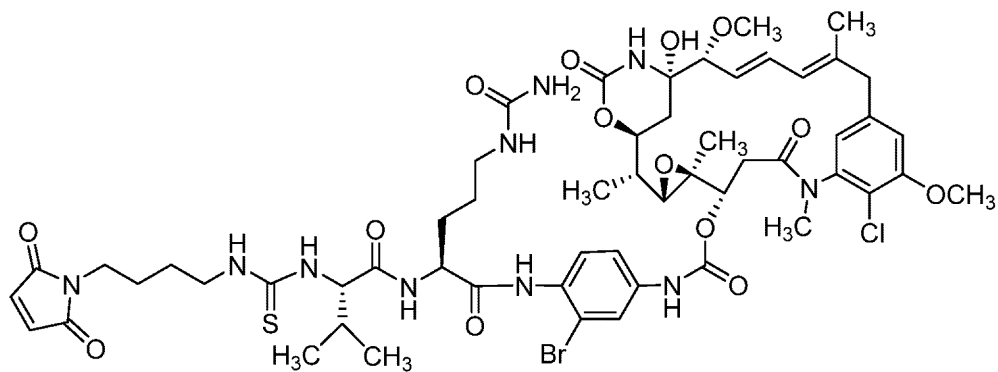
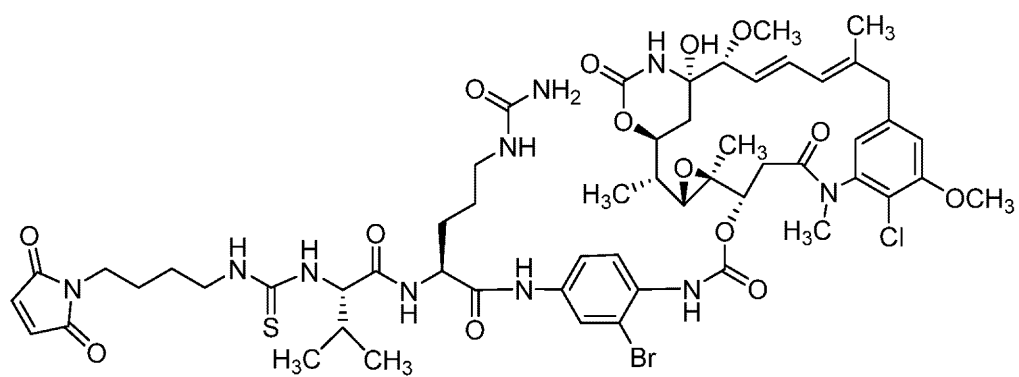
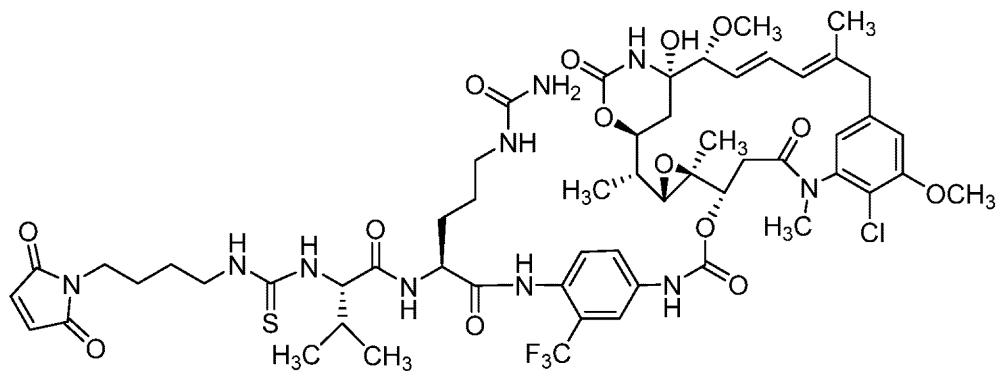
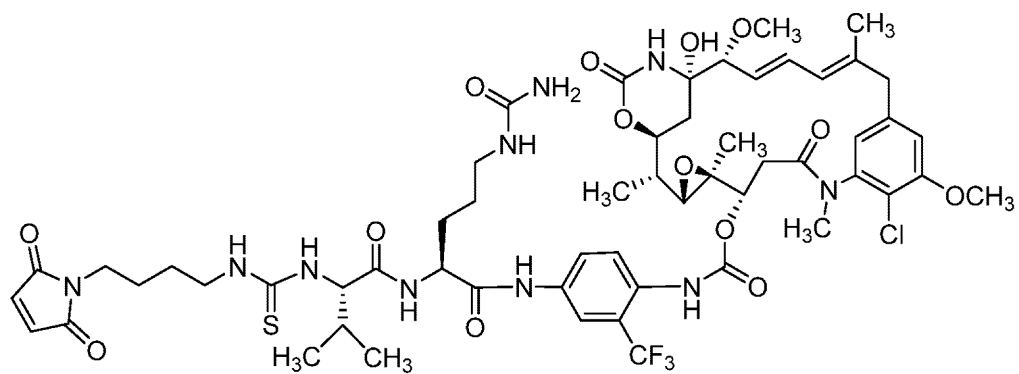


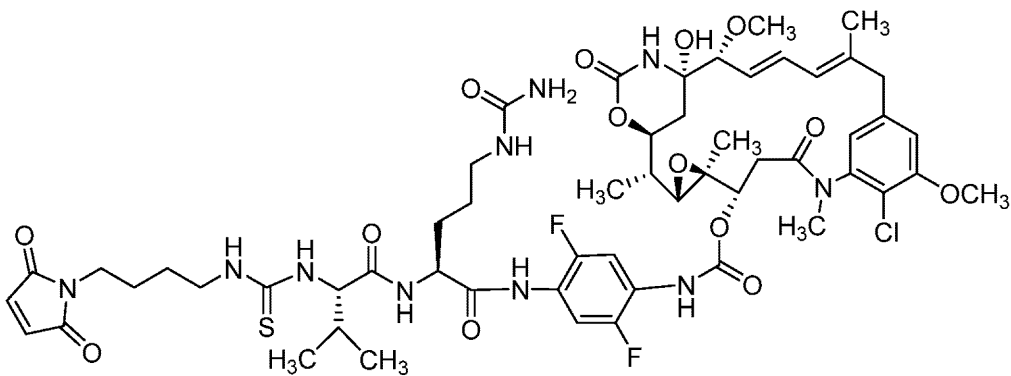
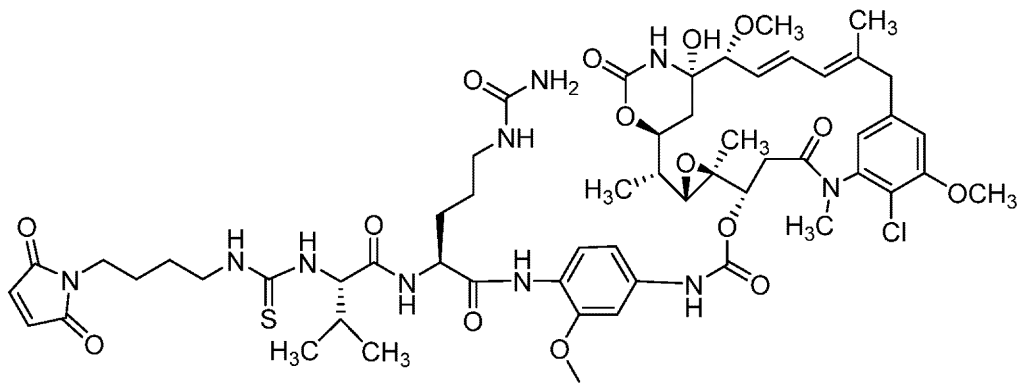
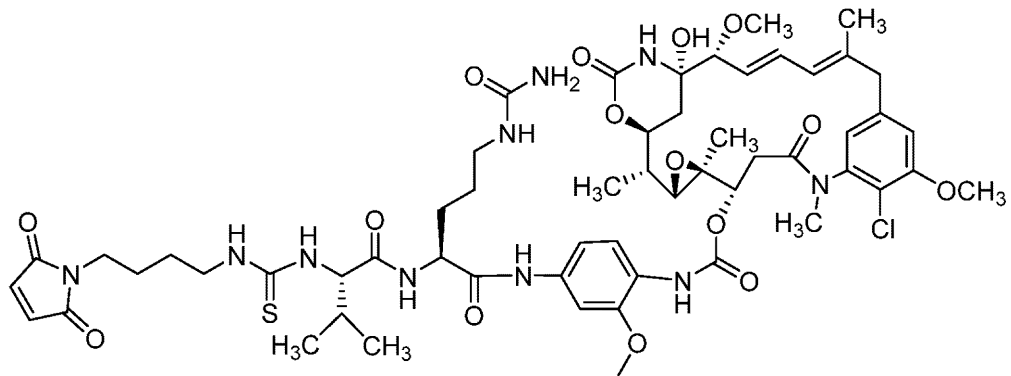
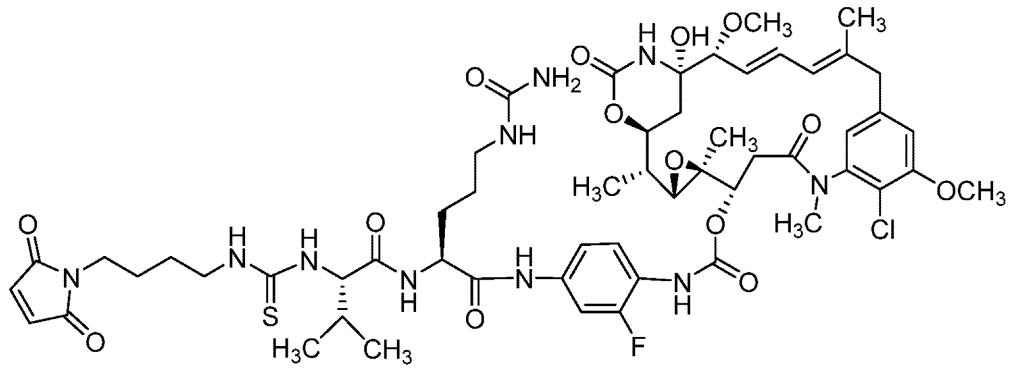


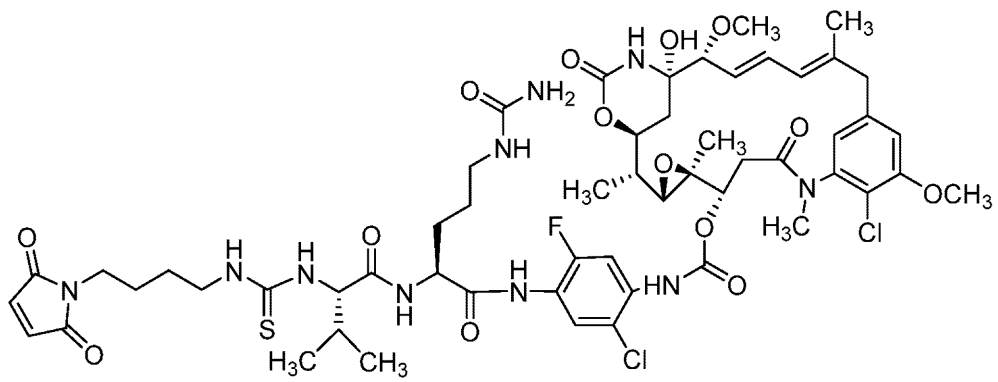
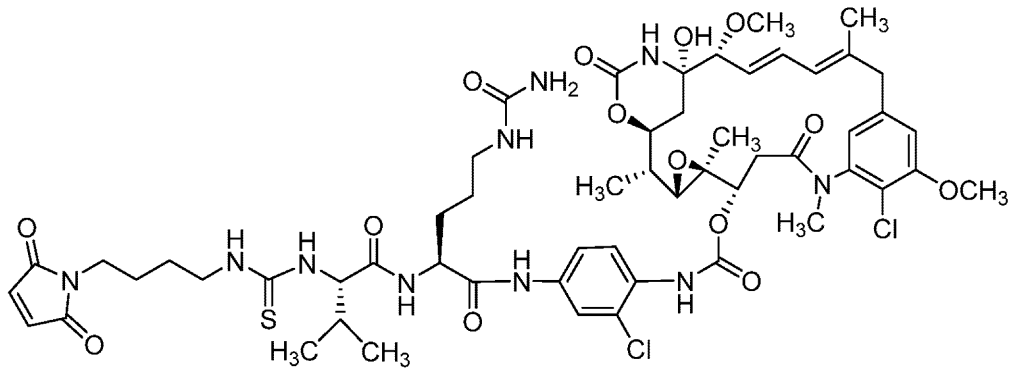


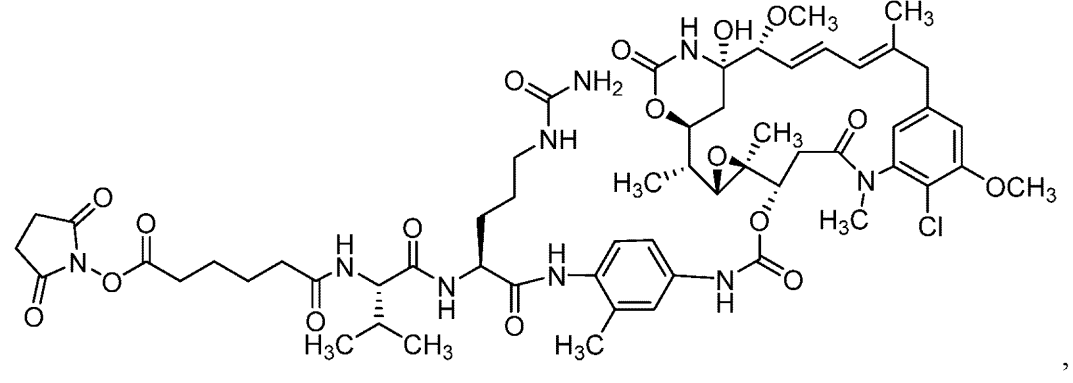
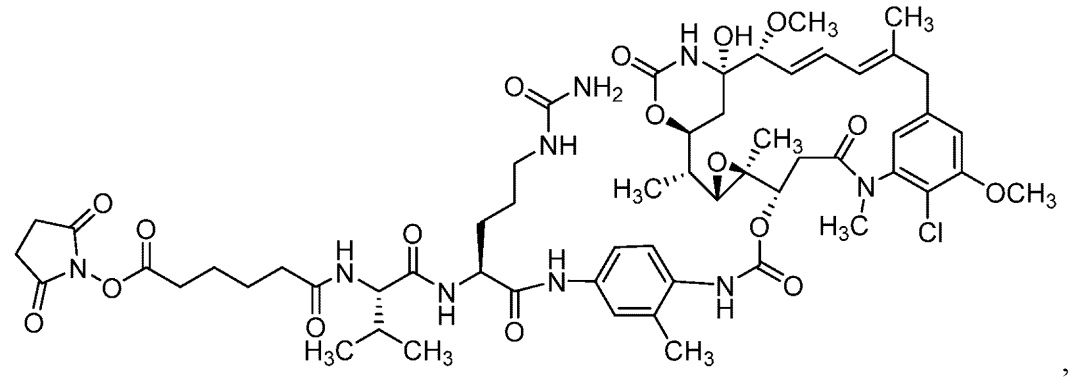
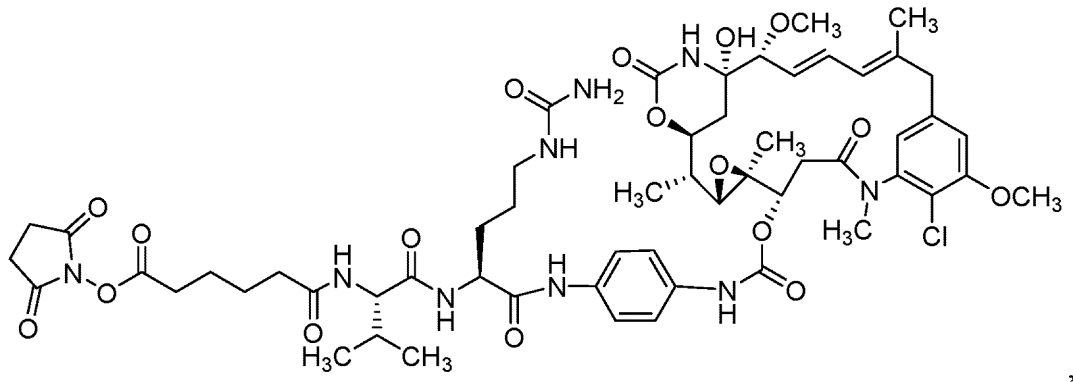


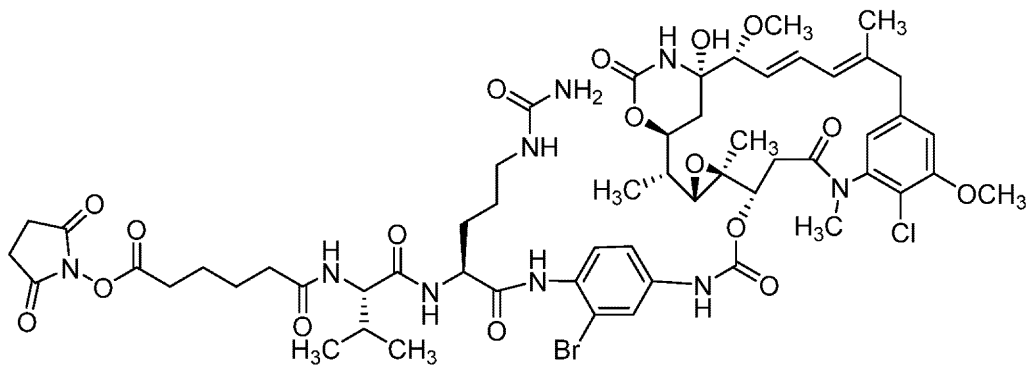
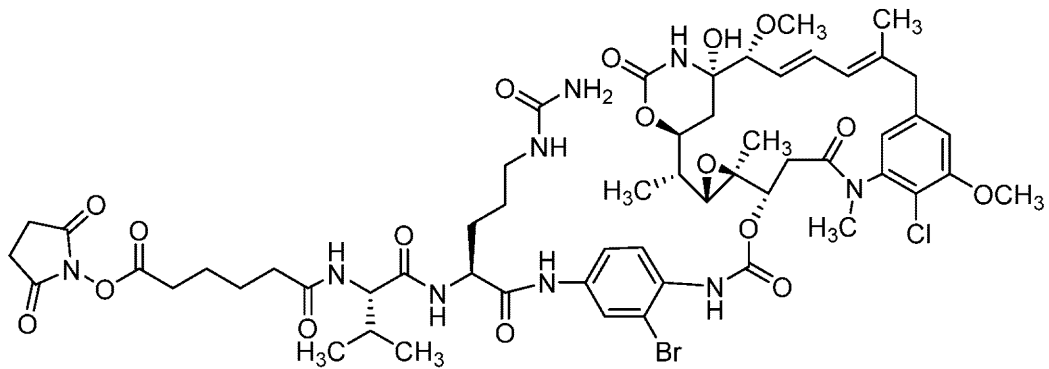
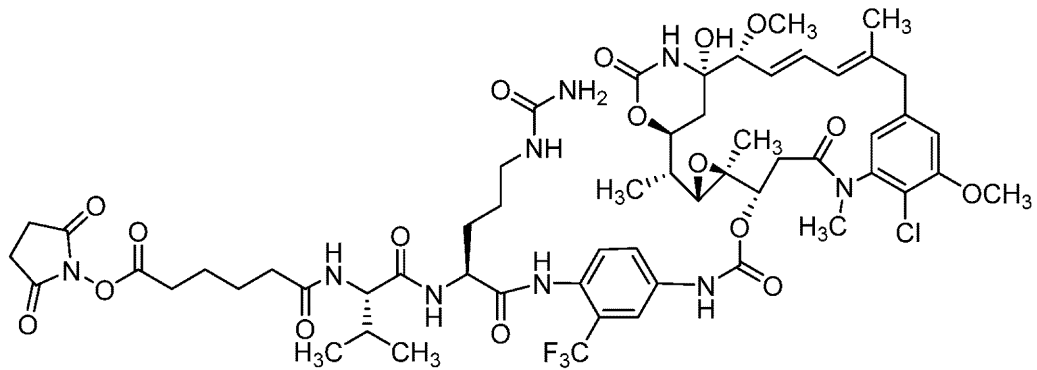
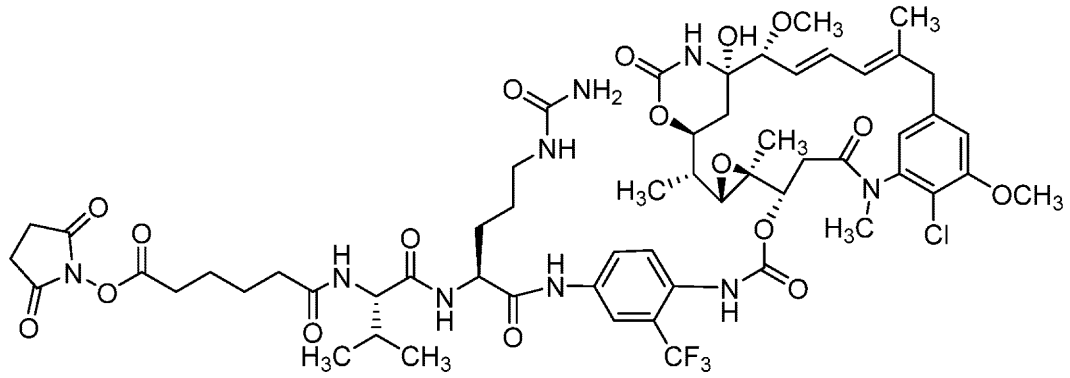


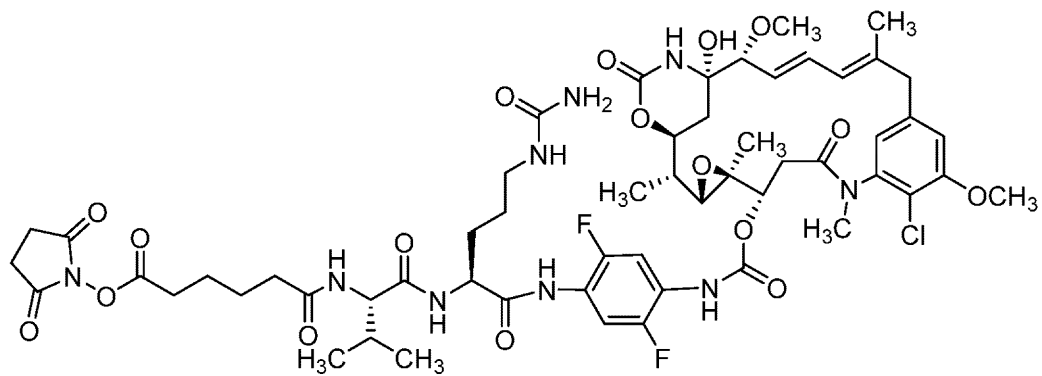
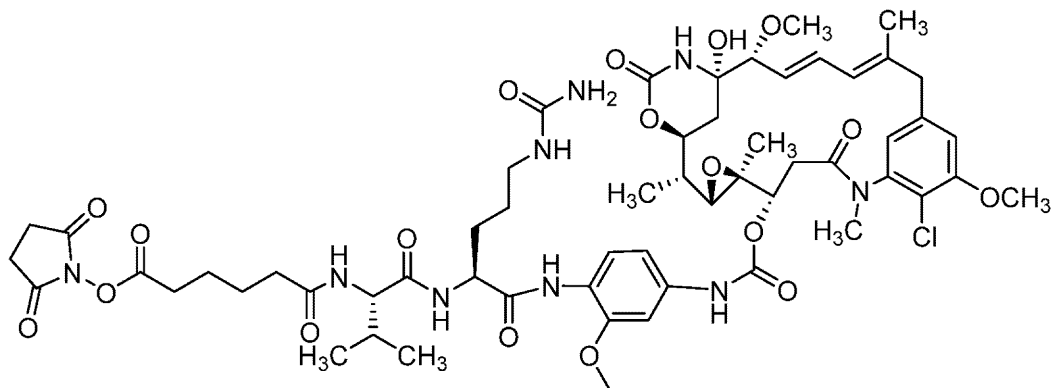
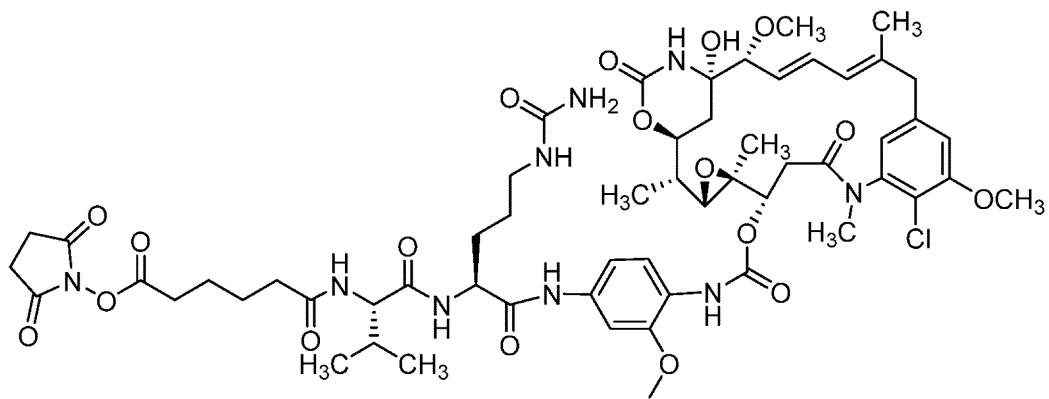
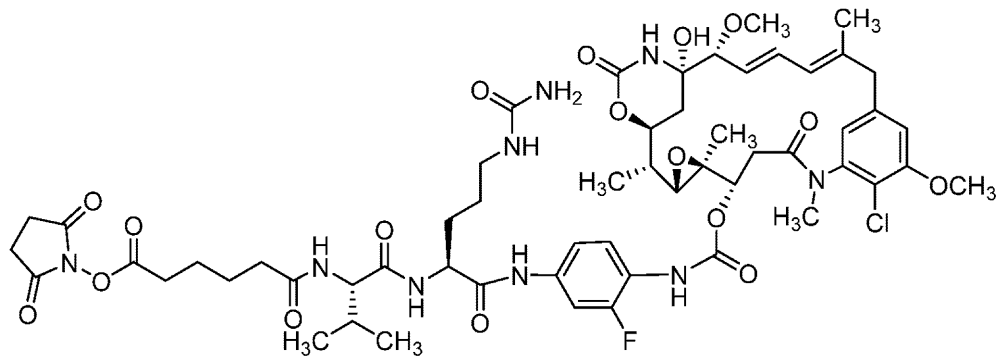


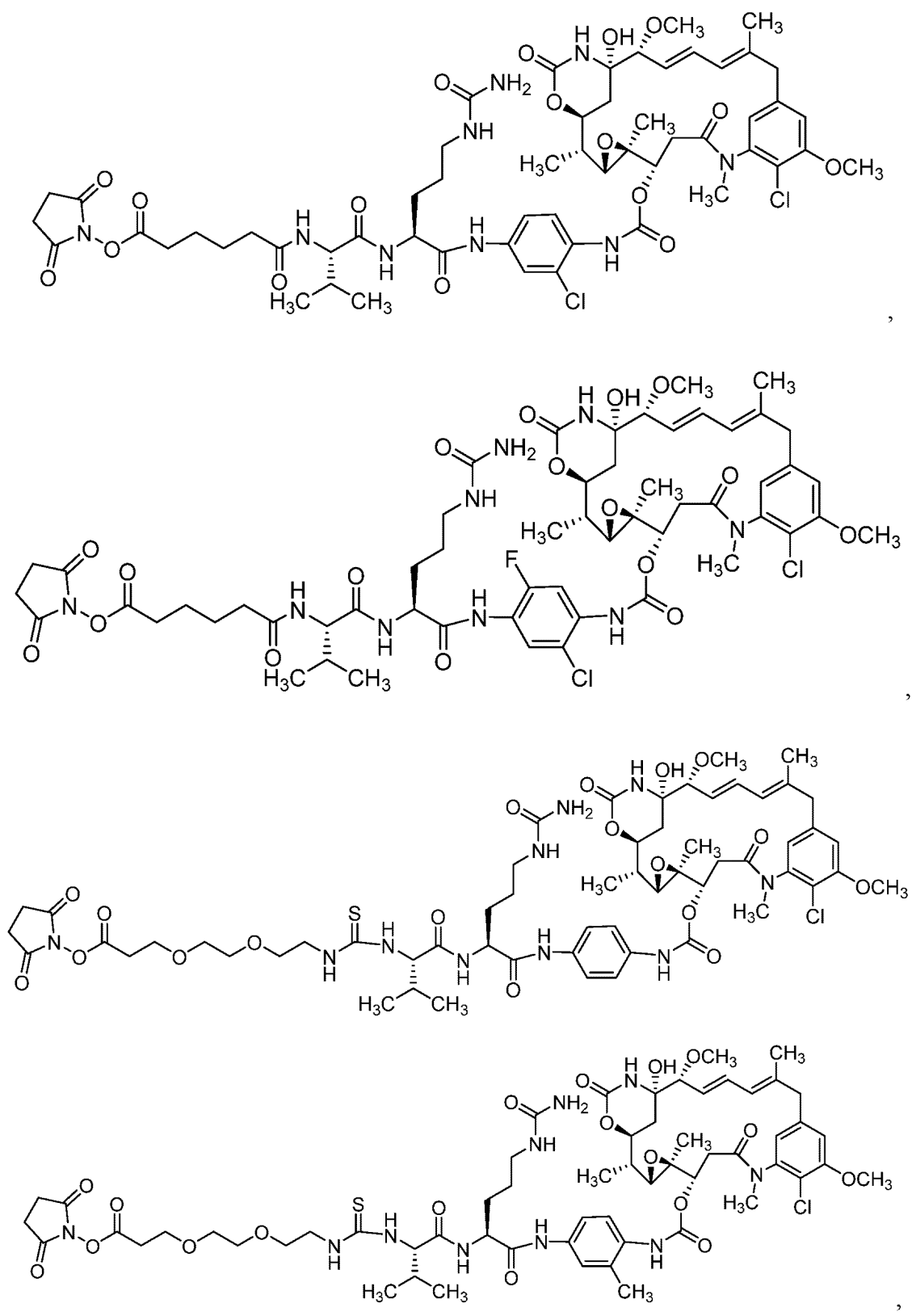


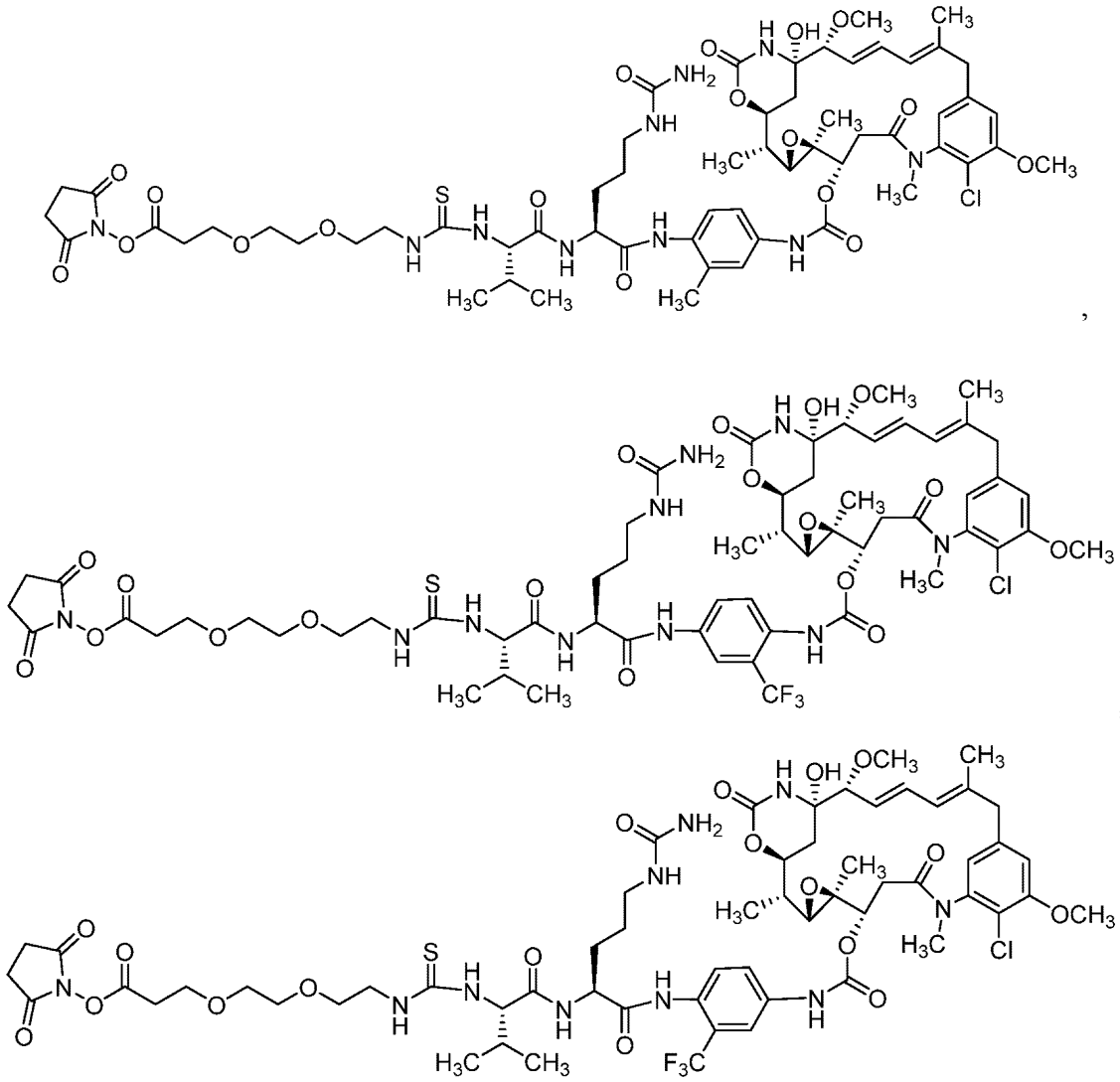


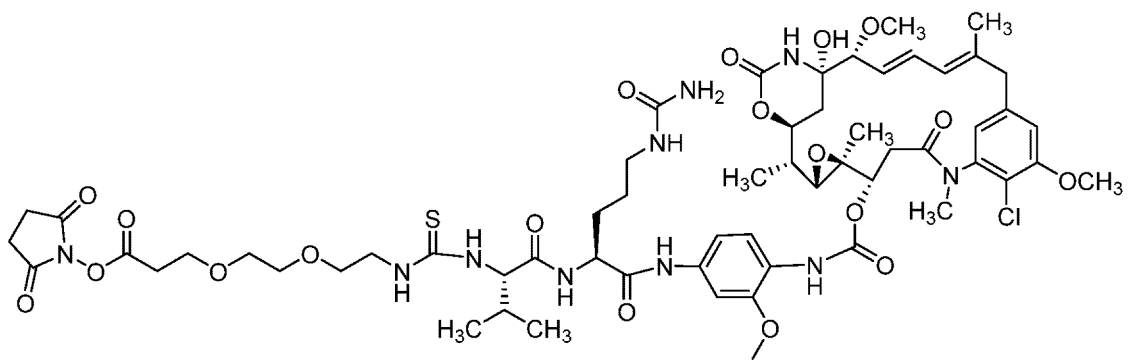
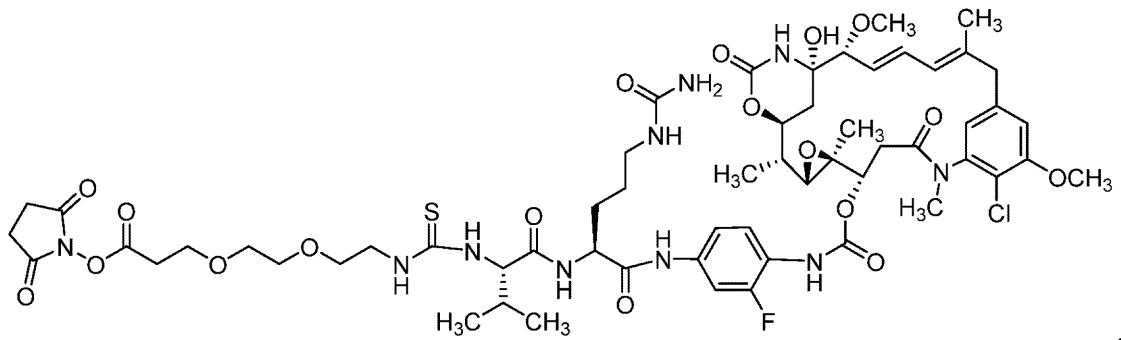
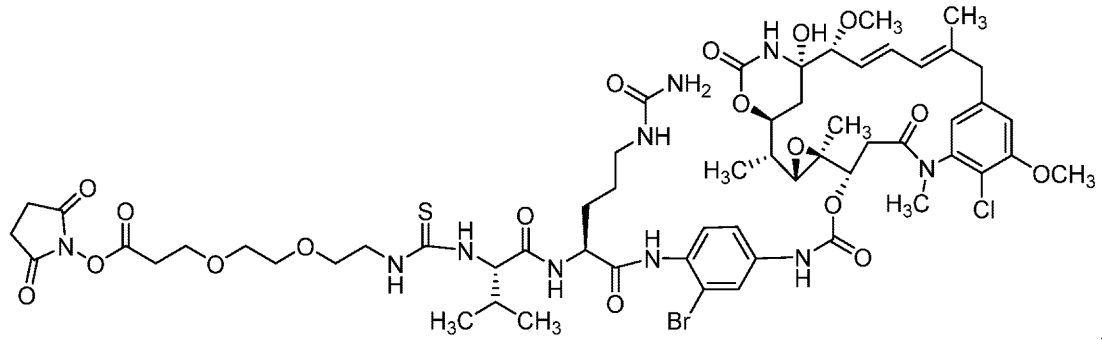
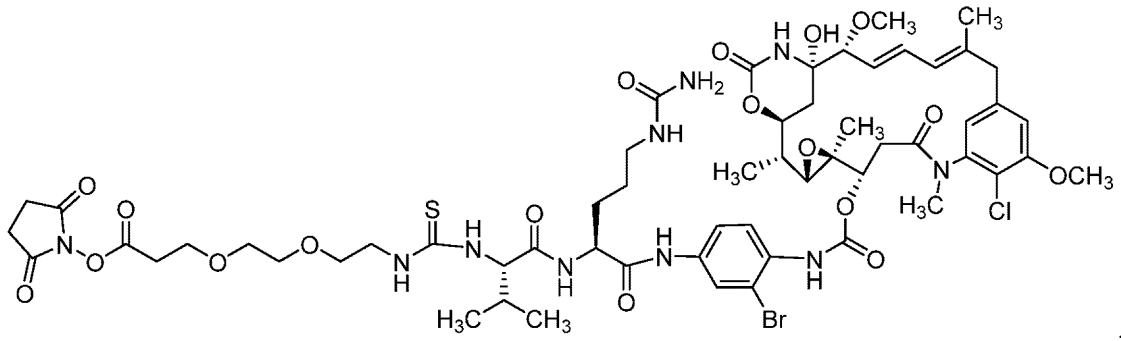


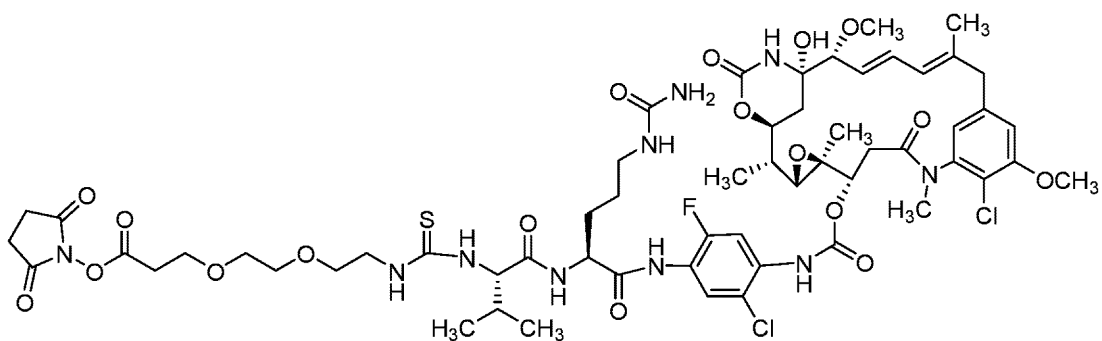
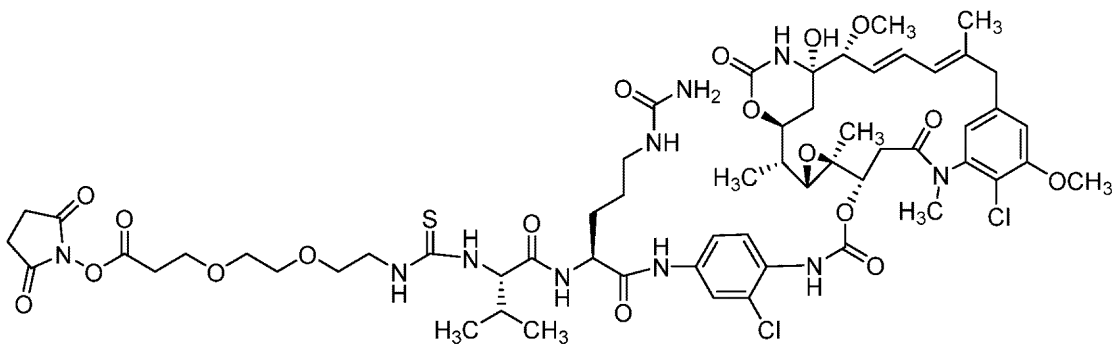
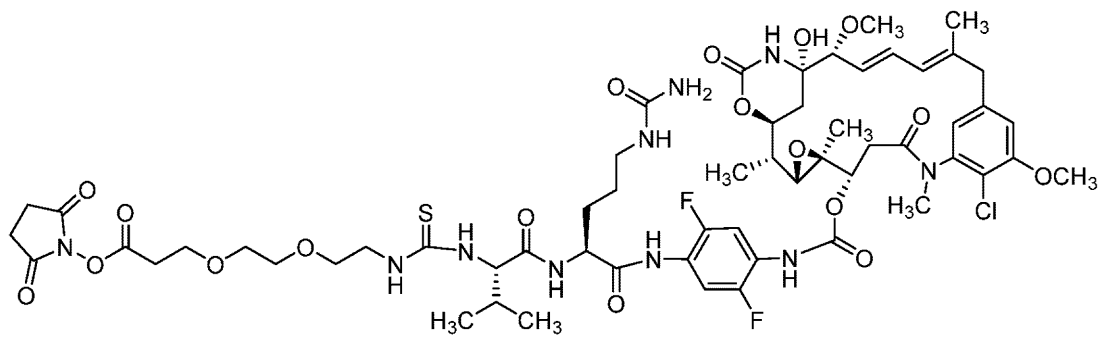
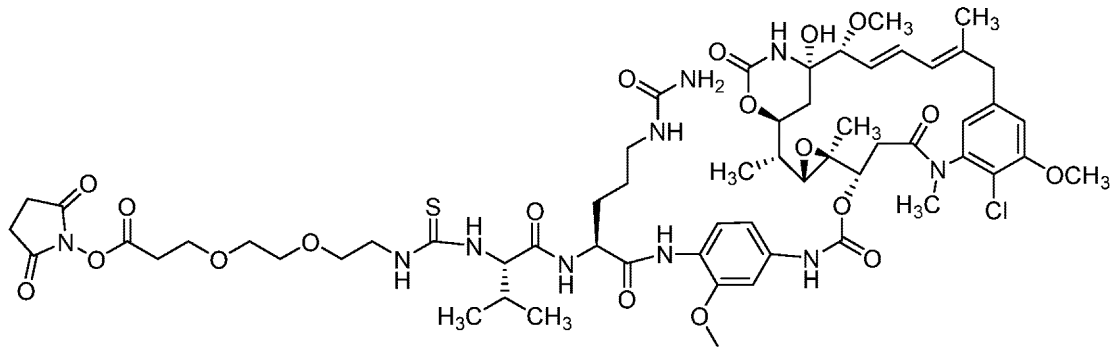


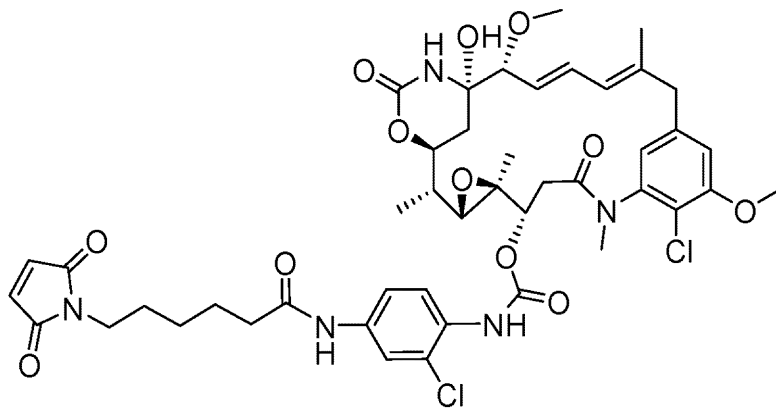
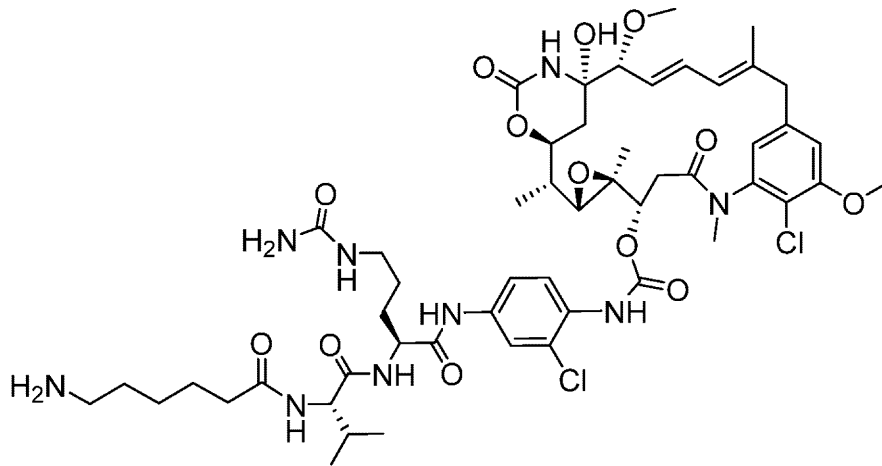
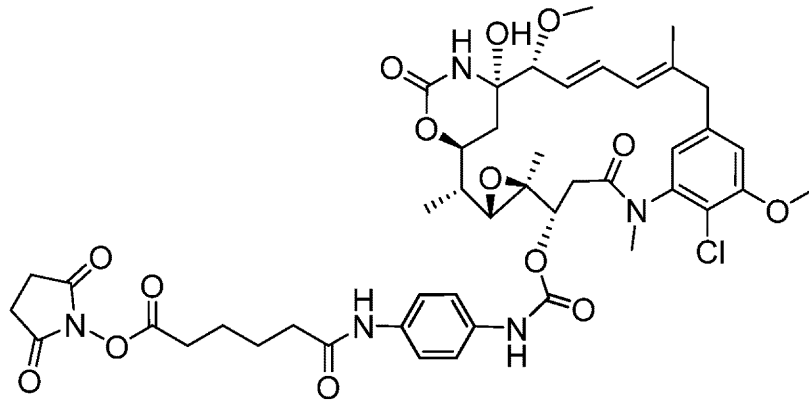




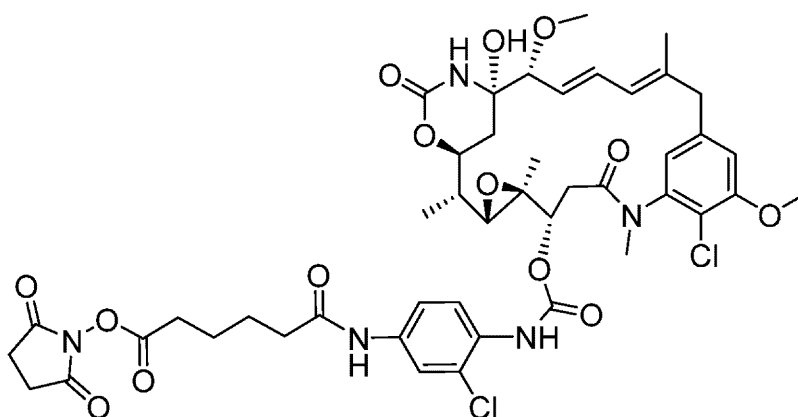








, 及び

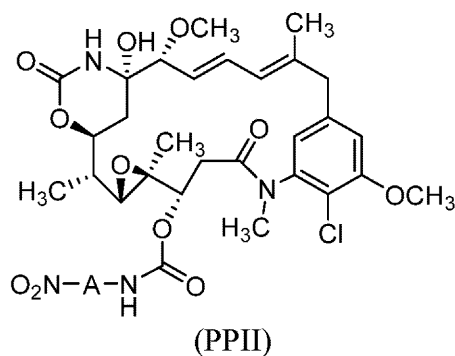


から選択される、構成47記載の化合物。

(構成53)

式P11の化合物：

(化52)

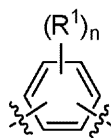


(式中、Aはアリーレン又はヘテロアリーレンである)。

(構成54)

Aが：

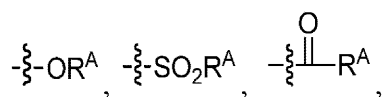
(化53)



であり；

R^1 が、出現する毎に独立に、アルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシ、アリー
ル、アルカリール、アリールアルキル、ハロ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ヘテロア
ルキル、ヘテロアリール、ヘテロシクロアルキル、シアノ、ニトロ、

(化54)



及びアジドから選択され；

R^A がアルキルであり；

nが0~4の整数である、

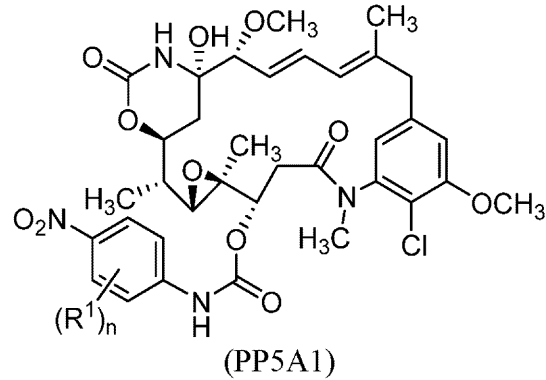
構成53記載の化合物。

(構成 5 5)

R¹ が、出現する毎に独立に、アルキル、アルコキシ、ハロ、ハロアルキル、及びヘテロシクロアルキルから選択される、構成54記載の化合物。

(構成 5 6)

前記式PPIIの化合物が、式PP5A1の化合物：

(化 5 5)

であり、

式中：

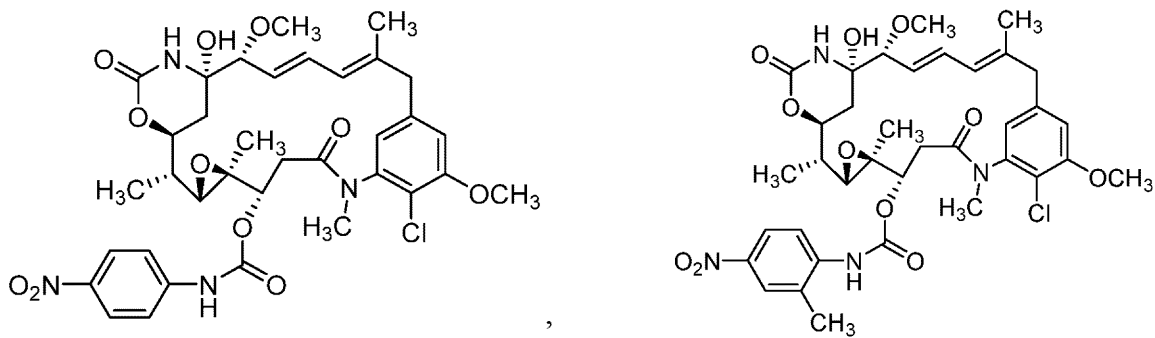
R¹ が、出現する毎に独立に、アルキル、アルコキシ、ハロ、ハロアルキル、及びヘテロシクロアルキルから選択され；かつ

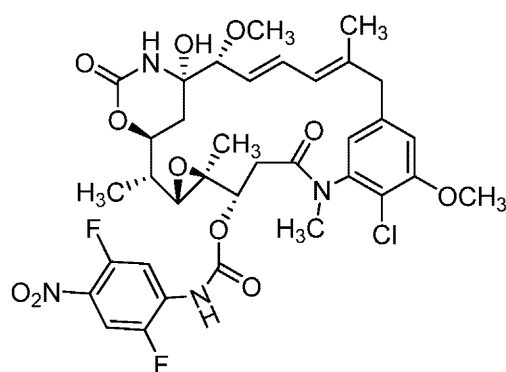
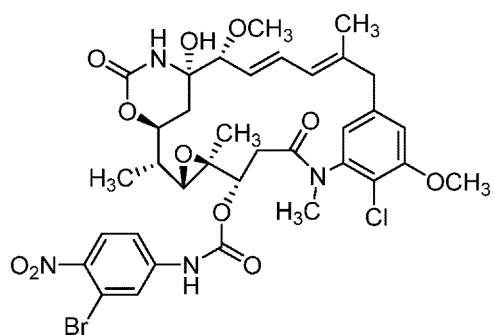
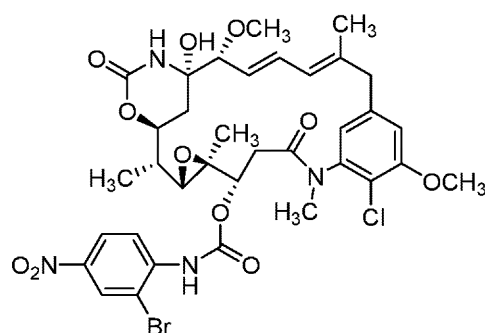
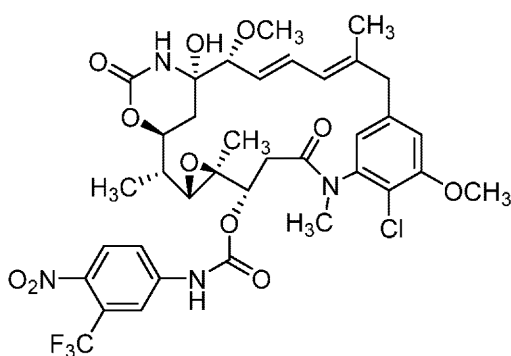
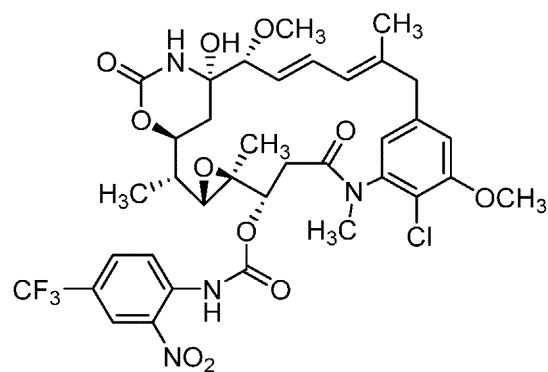
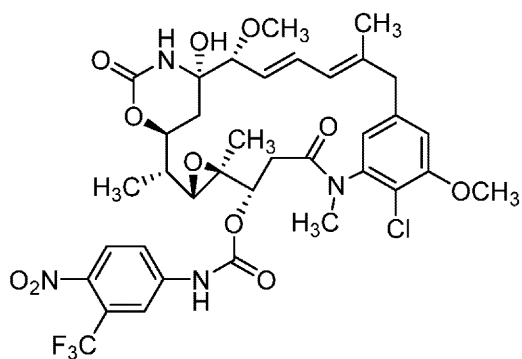
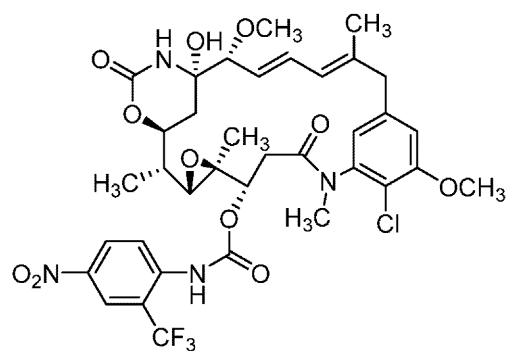
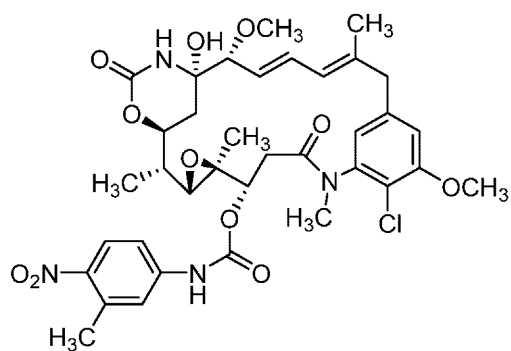
nが0～4の整数である、

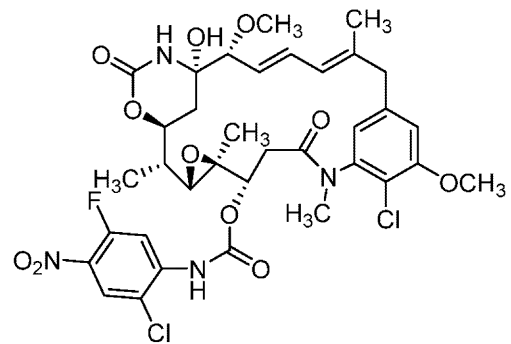
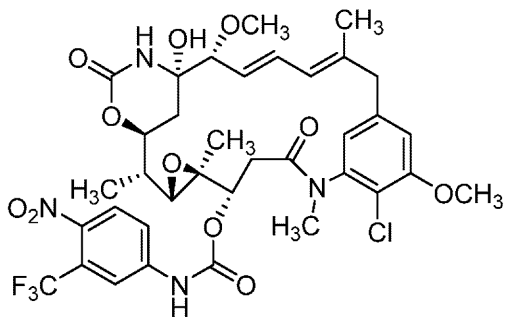
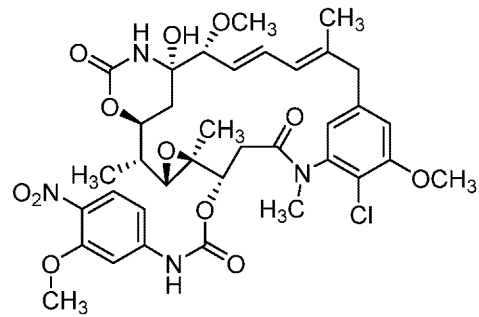
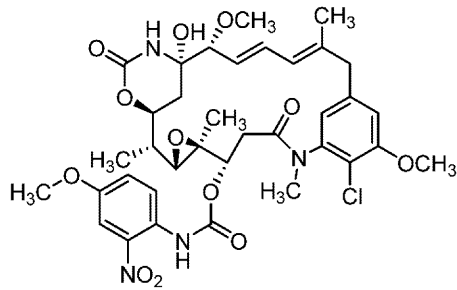
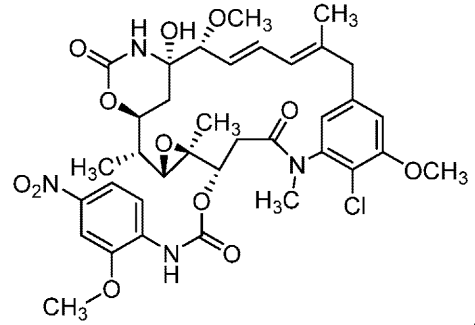
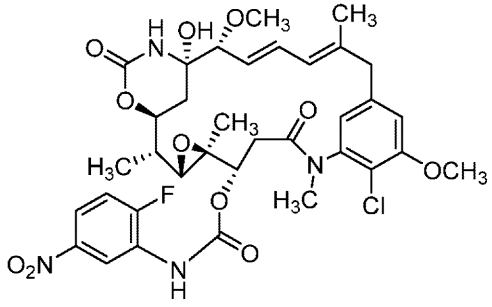
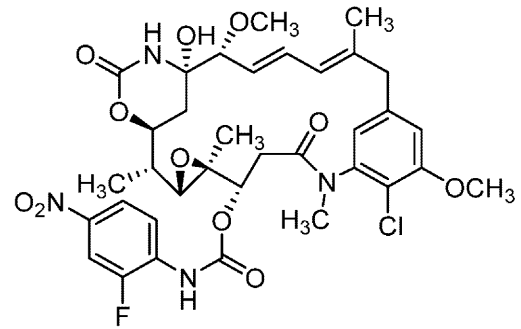
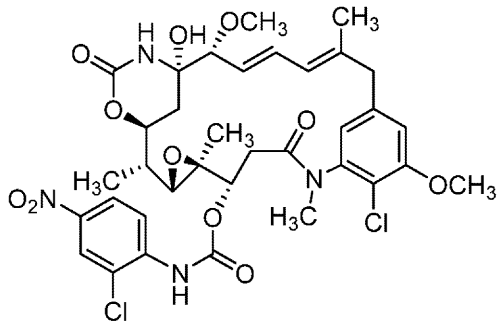
構成53～55のいずれか一項記載の化合物。

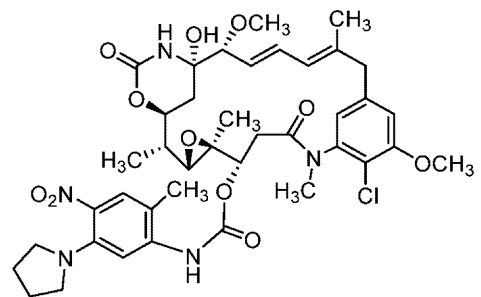
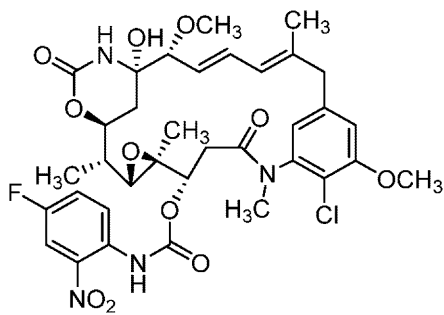
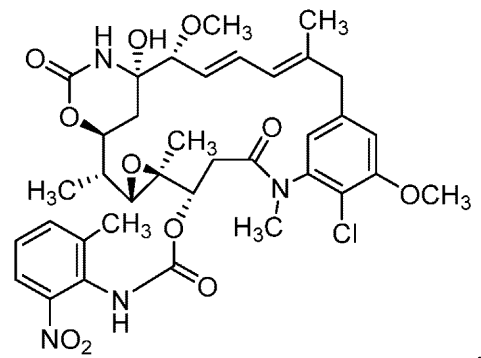
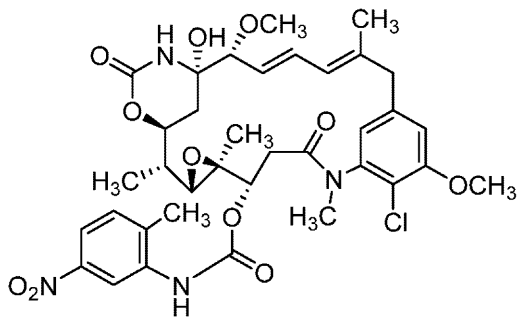
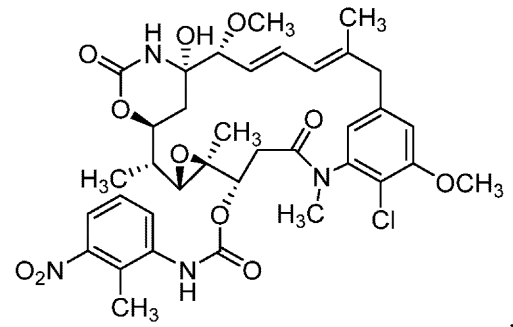
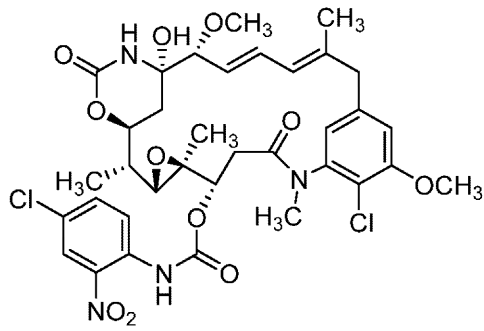
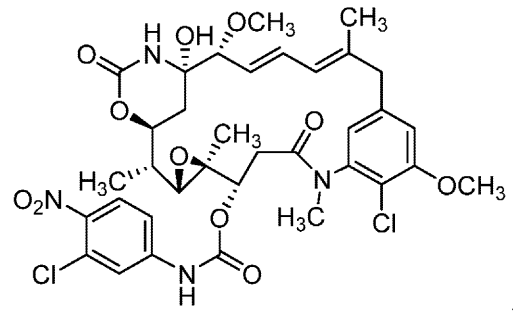
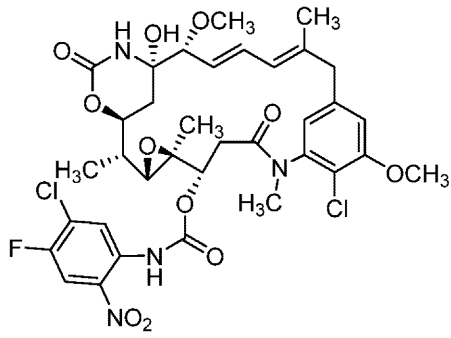
(構成 5 7)

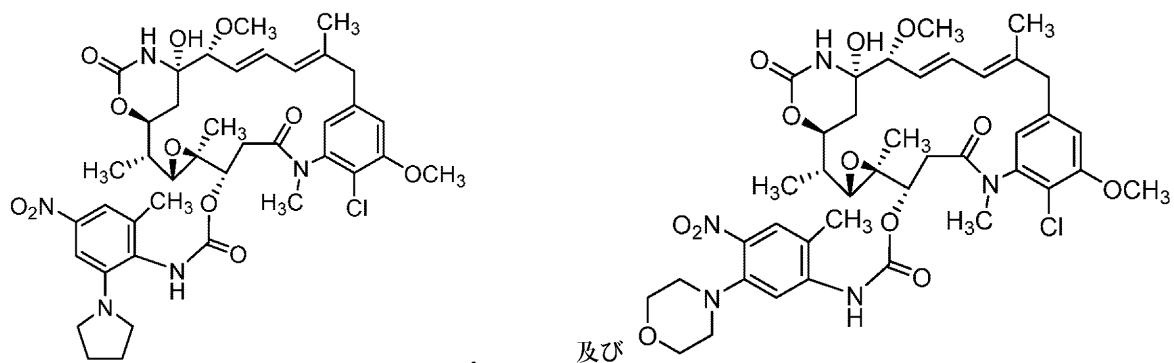
前記化合物が：

(化 5 6)







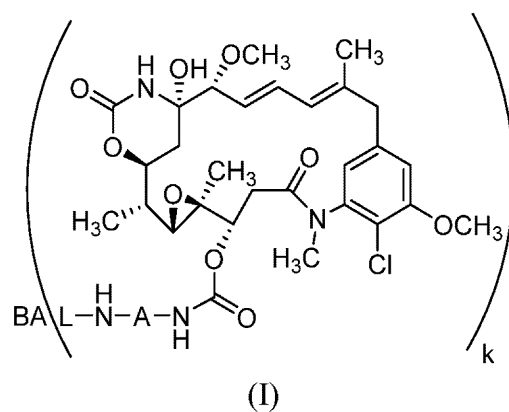


から選択される、構成53～55のいずれか一項記載の化合物。

(構成58)

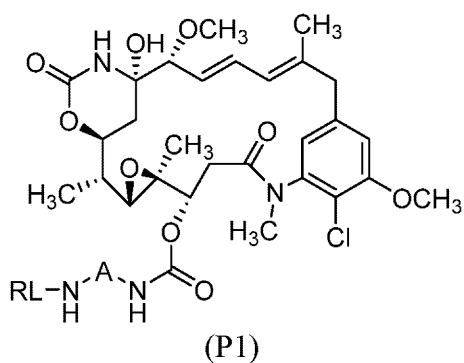
式(I)の化合物:

(化57)



を調製する方法であって、P1の化合物:

(化58)



をコンジュゲーション条件下で結合剤と接触させることを含み、
ここで:

Aがアリーレン又はヘテロアリーレンであり;

Lがリンカーであり;

BAが結合剤であり;

kが1～10の整数であり;かつ

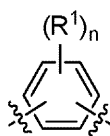
RLが反応性リンカーである、

前記方法。

(構成59)

Aが:

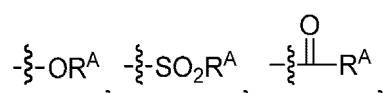
(化59)



であり;

R^1 が、出現する毎に独立に、アルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシ、アリー
ル、アルカリール、アリールアルキル、ハロ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ヘテロア
ルキル、ヘテロアリール、ヘテロシクロアルキル、シアノ、ニトロ、

(化60)



及びアジドから選択され;

R^A がアルキルであり;かつ

n が0~4の整数である、

構成58記載の方法。

(構成60)

R^1 が、出現する毎に独立に、アルキル、アルコキシ、ハロ、ハロアルキル、及びヘテロ
シクロアルキルから選択され;かつ

n が0~4の整数である、

構成59記載の方法。

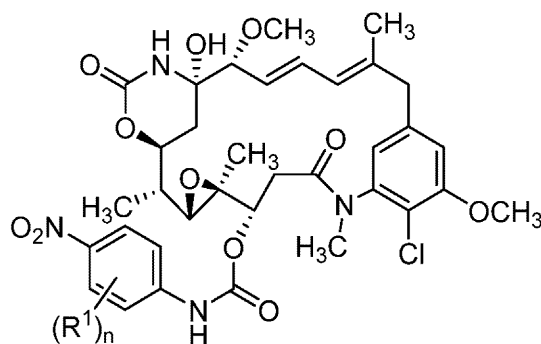
(構成61)

前記式P1の化合物が、式IIの化合物をRLと接触させることにより調製され、

RLが反応性リンカーであり;かつ

該式IIの化合物が、式PP5Aの化合物を好適な還元剤と接触させることにより調製され:

(化61)

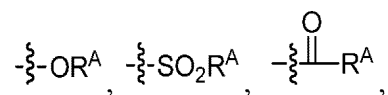


(PP5A)

ここで:

R^1 が、出現する毎に独立に、アルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシ、アリー
ル、アルカリール、アリールアルキル、ハロ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ヘテロア
ルキル、ヘテロアリール、ヘテロシクロアルキル、シアノ、ニトロ、

(化62)



及びアジドから選択され;

R^A がアルキルであり;

n が0~4の整数であり;かつ

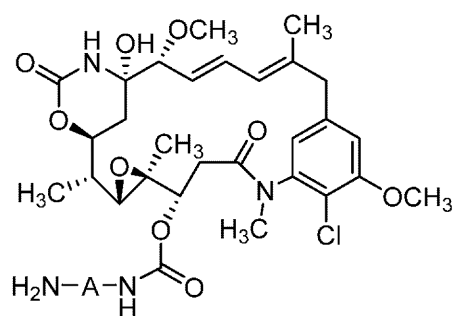
該好適な還元剤が、金属、金属箔、金属粉、金属の粉塵、金属アマルガム、又は金属の削り屑から選択される、

構成58記載の方法。

(構成62)

式IIの化合物:

(化63)



(II),

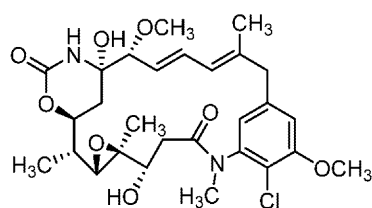
(式中:

Aはアリーレン又はヘテロアリーレンである)

を製する方法であって:

(a)式P2の化合物

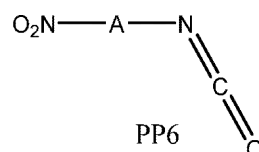
(化64)



P2

を、式PP6の化合物:

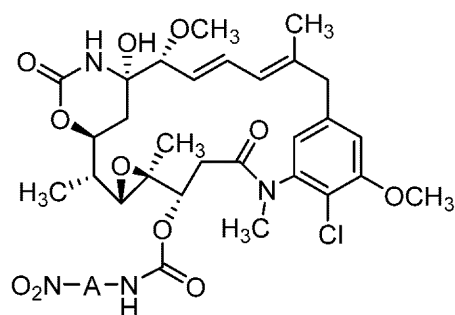
(化65)



PP6

と、ルイス酸合成条件下で接触させて、PPIIの化合物:

(化66)



(PPII)

を形成させること;及び

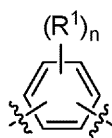
(b) 該式PPIIの化合物を還元剤と接触させることにより、該式PPIIの化合物を還元して、式IIの化合物を形成させること

を含む、前記方法。

(構成63)

Aが:

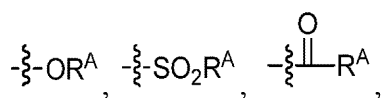
(化67)



であり;

R¹が、出現する毎に独立に、アルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシ、アリー
ル、アルカリール、アリールアルキル、ハロ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ヘテロア
ルキル、ヘテロアリール、ヘテロシクロアルキル、シアノ、ニトロ、

(化68)



及びアジドから選択され;

R^Aがアルキルであり;

nが0~4の整数である、

構成62記載の方法。

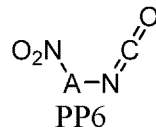
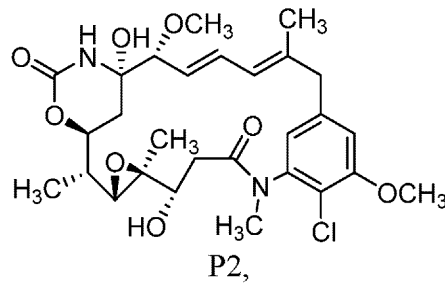
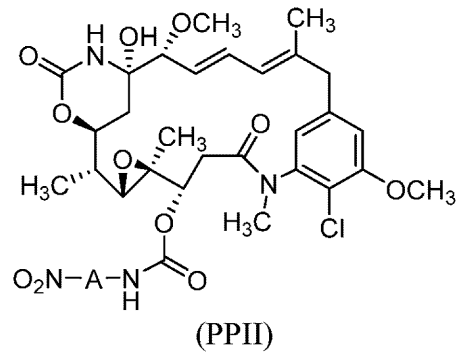
(構成64)

R¹が、出現する毎に独立に、アルキル、アルコキシ、ハロ、ハロアルキル、及びヘテロ
シクロアルキルから選択される、構成62記載の方法。

(構成65)

式PPIIの化合物を作製する方法であって、式P2の化合物を、式PP6の化合物と、ルイス
酸合成条件下で接触させること:

(化69)



を含み;

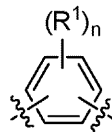
ここで:

Aがアリーレン又はヘテアリーレンである、前記方法。

(構成66)

Aが

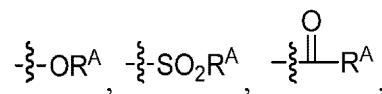
(化70)



であり;

R¹が、出現する毎に独立に、アルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシ、アリー
ル、アルカール、アリーラルキル、ハロ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ヘテロア
ルキル、ヘテアリール、ヘテロシクロアルキル、シアノ、ニトロ、

(化71)



及びアジドから選択され;

R^Aがアルキルであり;

nが0~4の整数である、

構成65記載の方法。

(構成67)

R¹が、出現する毎に独立に、アルキル、アルコキシ、ハロ、ハロアルキル、及びヘテロ

シクロアルキルから選択される、
構成65記載の方法。