

【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 26 年 11 月 27 日 (2014.11.27)

【公表番号】特表 2012-526045 (P2012-526045A)

【公表日】平成 24 年 10 月 25 日 (2012.10.25)

【年通号数】公開・登録公報 2012-044

【出願番号】特願 2012-507632 (P2012-507632)

【国際特許分類】

C 07 C 319/20 (2006.01)

C 07 C 323/58 (2006.01)

C 07 D 209/34 (2006.01)

C 07 D 209/30 (2006.01)

【F I】

C 07 C 319/20

C 07 C 323/58

C 07 D 209/34

C 07 D 209/30

【誤訳訂正書】

【提出日】平成 26 年 10 月 7 日 (2014.10.7)

【誤訳訂正 1】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0001

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0001】

本発明は、好ましくは薬学および／または農業におけるファインケミカルおよび活性成分を合成するための中間体のための、生物学的に活性な化合物の化学合成の技術分野に関するものである。

【誤訳訂正 2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0017

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0017】

この様式で調製された化合物(4)は、好ましくは、同様に薬学および／または農業におけるファインケミカルおよび活性成分を合成するための中間体であり得る、オキシインドール(1,3-ジヒドロ-2H-インドール-2-オン)へのさらなるプロセッシングも可能にする。

【誤訳訂正 3】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0045

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0045】

したがって、本発明はまた、薬学または農業におけるファインケミカルおよび活性成分を調製するための中間体としての、本発明に従った上記の方法によって得ることができ新規な式(4'):

【誤訳訂正 4】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0051

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0051】

本発明はまた、薬学または農業におけるファインケミカルおよび活性成分を調製するための中間体としての、本発明に従った上記の方法によって得ることができ新規な式(8')

【誤訳訂正5】

【訂正対象書類名】特許請求の範囲

【訂正対象項目名】全文

【訂正方法】変更

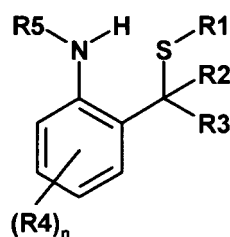
【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(4)

【化1】



(4)

[式中、

R1は、C1 - C6アルキル、置換されたアルキル、アリールまたは置換されたアリールであり、

R2は、H、C1 - C6アルキルまたは置換されたアルキルであり、

R3は、-CO-R1または-CO-X

[式中、Xは、OR1、SR1、NR2R2' (式中、R2'はR2と同様に定義され、R2と同一であるまたはR2と異なっていてよく、R2およびR2'は環を形成し得る。)、SO(n')-R1 (式中、n'は、0、1または2であり得る。)、-CN、-NO2、アリールまたはヘテロアリールである。]

であり、

R4は、F、Cl、Br、I、CF3、CN、NO2またはCOX

[式中、Xは、OR1、SR1またはNR2R2' (式中、R2'は上記のR2と同様に定義され、R2と同一であるまたはR2と異なっていてよい。)である。]

であり、

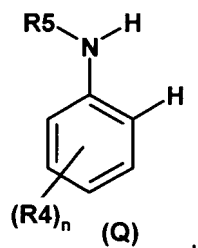
nは、1 - 4であり、

R5は、H、C1 - C6アルキルまたは置換されたアルキルである。]

の化合物を調製するための方法であって、

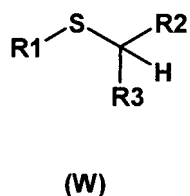
アニリン(式Qの化合物)：

【化 2】



(式中、基 R 4、n および R 5 は、式 (4) で定義されたものである。)
 およびチオエーテル (式 W の化合物) :

【化 3】



(式中、基 R 1、R 2 および R 3 は、式 (4) で定義されたものである。)
 の混合物を、塩素化剤としての塩化スルフルル (SO_2Cl_2) および有機溶媒の存在下で、 -60 から -10 の間の範囲の反応温度で反応させて、式 (4) の化合物を得ることを含み、
アニリン (Q) の添加後、さらなる第三級アミンの添加が省かれる、前記方法。

【請求項 2】

反応が、C 1 - C 6 アルキルアセテートおよびシクロアルキルアセテート、C 1 - C 6 アルキルおよびシクロアルキルプロピオネート、C 1 - C 6 アルキルおよびシクロアルキル n - ブチレート、イソブチレート、ペンタノエートおよびヘキサノエートならびにシクロペンタノエートおよびシクロヘキサノエートからなる群から選択されるエステル溶媒内で実施される、またはそれらの混合物内で実施される、または他の溶媒との混合物内で実施される、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 3】

生成物の良好な収量のために、最大 1 当量の塩素化剤が、1 当量のチオエーテル (W) および 2 . 0 から 5 . 0 当量のアニリン (Q) の混合物に添加される、請求項 1 または 2 に記載の方法。

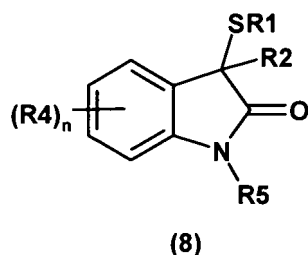
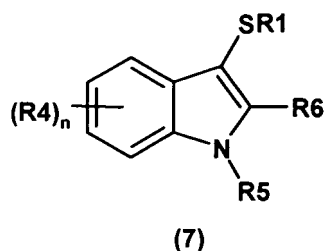
【請求項 4】

アニリンの総量の 1 から 99 重量%の間の、アニリンの一部の量が、塩素化剤と別個に、しかしこの塩素化剤と同時にまたは部分的に同時に添加される、請求項 1 から 3 のいずれかに記載の方法。

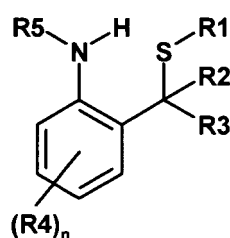
【請求項 5】

式 (7) および (8) :

【化 4】



[式中、
 R 1 は、C 1 - C 6 アルキル、置換されたアルキル、アリールまたは置換されたアリールであり、
 R 2 は、H、C 1 - C 6 アルキルまたは置換されたアルキルであり、
 R 4 は、F、Cl、Br、I、CF₃、CN、NO₂ または COX
 [式中、X は、OR 1、SR 1 または NR 2 R 2 ' (式中、R 2 ' は上記の R 2 と同様に定義され、R 2 と同一であるまたは R 2 と異なっていてよい。) である。]
 であり、
 n は、1 - 4 であり、
 R 5 は、H、C 1 - C 6 アルキルまたは置換されたアルキルであり、
 R 6 は、C 1 - C 6 アルキルまたは置換されたアルキルであり、または OH である。]
 の化合物を調製するための方法であって、
 請求項 1 から 4 のいずれか一項に記載の方法によって調製される、式 (4) :
 【化 5】



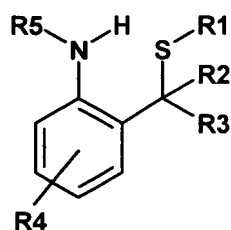
(4)

[式中、基 R 1、R 2、R 4、n および R 5 は上述のように定義され、R 3 は、- CO - R 1 または - CO - X [式中、X は、OR 1、SR 1、NR 2 R 2 ' (式中、R 2 ' は R 2 と同様に定義され、R 2 と同一であるまたは R 2 と異なっていてよく、R 2 および R 2 ' は環を形成し得る。)、SO (n ') - R 1 (式中、n ' は、0、1 または 2 であり得る。)、- CN、- NO₂、アリールまたはヘテロアリールである。] である。]
 の化合物を、
 場合によっては酸性触媒の存在下で、式 (4) の化合物を単離することなく反応させて、
 式 (7) のインドールまたは式 (8) のオキシインドールを得る方法。

【請求項 6】

農業における活性成分を調製するための、式 (4 ')

【化 6】



(4')

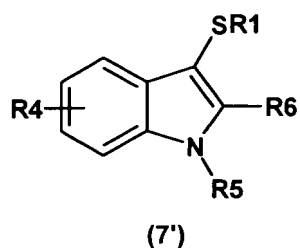
[式中、
 R 1 は、C 2 - C 6 アルキルまたはベンジルであり、
 R 2 は、H であり、
 R 3 は、CO₂R'' (式中、R'' は、C 1 - C 6 アルキルまたはベンジルエステルであり得る。) であり、
 R 4 は、2 - F または 2 - Cl であり、
 R 5 は、H または C 1 - C 4 アルキルである。]

の化合物の使用。

【請求項 7】

農業における 活性成分を調製するための、式 (7 ')

【化 7】



(式中、

R 1 は、C 2 - C 6 アルキルまたはベンジルであり、

R 4 は、7 - Fまたは7 - C 1であり、

R 5 は、HまたはC 1 - C 4 アルキルであり、

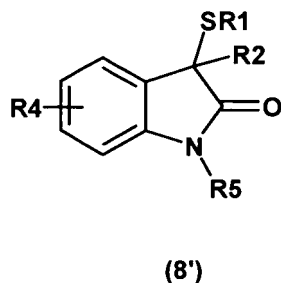
R 6 は、C 1 - C 6 アルキルである。)

の化合物の使用。

【請求項 8】

農業における 活性成分を調製するための、式 (8 ')

【化 8】



(式中、

R 1 は、C 2 - C 6 アルキルまたはベンジルであり、

R 2 は、Hであり、

R 4 は、7 - Fまたは7 - C 1であり、

R 5 は、HまたはC 1 - C 4 アルキルである。)

の化合物の使用。