

【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 27 年 9 月 17 日 (2015.9.17)

【公表番号】特表 2013-526498 (P2013-526498A)

【公表日】平成 25 年 6 月 24 日 (2013.6.24)

【年通号数】公開・登録公報 2013-033

【出願番号】特願 2013-509511 (P2013-509511)

【国際特許分類】

C 0 7 D 209/34 (2006.01)

A 0 1 N 43/38 (2006.01)

A 0 1 P 13/00 (2006.01)

A 0 1 P 7/04 (2006.01)

A 0 1 P 3/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 209/34

A 0 1 N 43/38

A 0 1 P 13/00

A 0 1 P 7/04

A 0 1 P 3/00

【誤訳訂正書】

【提出日】平成 27 年 7 月 31 日 (2015.7.31)

【誤訳訂正 1】

【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

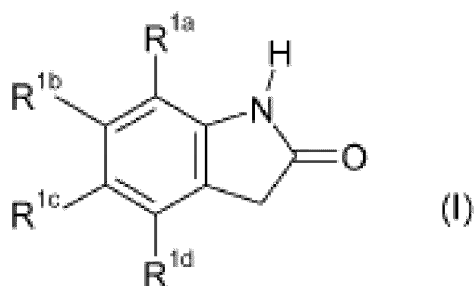
【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) の化合物

【化 1】



[ 式中、

R<sup>1a</sup> から R<sup>1d</sup> は、水素、フッ素、塩素、臭素およびトリフルオロメチル、  
(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル (該アルキル基は、非置換または (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルコキシ  
もしくは (C<sub>3</sub> - C<sub>7</sub>) - シクロアルキルからなる群から選択される 1 つもしくは複数の  
置換基により置換される)、

(C<sub>3</sub> - C<sub>7</sub>) - シクロアルキル (該シクロアルキル基は、非置換または (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)  
- アルキルもしくは (C<sub>3</sub> - C<sub>7</sub>) - シクロアルキルもしくは (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルコキ  
シからなる群から選択される 1 つもしくは複数の置換基により置換される)、

(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルコキシ (該アルコキシ基は、分枝状または非分枝状の、非置換また

は (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルコキシもしくは (C<sub>3</sub> - C<sub>7</sub>) - シクロアルキルからなる群から選択される 1 つもしくは複数の置換基により置換される)、

(C<sub>3</sub> - C<sub>7</sub>) - シクロアルコキシ (該シクロアルコキシ基は、非置換または (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキルもしくは (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルコキシからなる群から選択される 1 つもしくは複数の置換基により置換される)、

(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルチオ (該アルキルチオ基は、分枝状または非分枝状の、非置換または (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキルもしくは (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルコキシからなる群から選択される 1 つもしくは複数の置換基により置換される)、

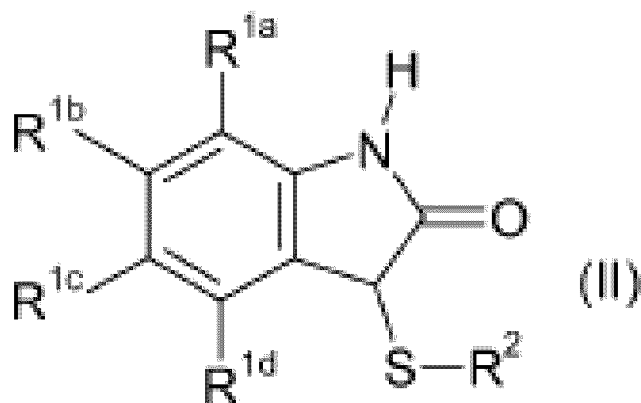
(C<sub>3</sub> - C<sub>7</sub>) - シクロアルキルチオ (該シクロアルキルチオ基は、非置換または (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキルもしくは (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルコキシからなる群から選択される 1 つもしくは複数の置換基により置換される)、ならびに

フェニルまたは 1 - ナフチルまたは 2 - ナフチルまたは五もしくは六員の 1 から 2 個のヘテロ原子を有する芳香族複素環 (ここで、該ヘテロ原子は O または N からなる群から互いに独立して選択され、及び、該アリアル基または該ヘテロアリアル基は、非置換または (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルコキシまたは (C<sub>3</sub> - C<sub>7</sub>) - シクロアルキルまたは (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキルチオからなる群から選択される 1 つまたは複数の置換基により置換される)、

からなる群から互いに独立して選択される]

を、式 (II) の化合物

【化 2】



[ 式中、

R<sup>1a</sup> から R<sup>1d</sup> は式 (I) において定義された通りであり、

R<sup>2</sup> は非置換または置換された (C<sub>1</sub> - C<sub>14</sub>) - アルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>7</sub>) - シクロアルキル、ベンジルまたは CH<sub>2</sub> - C(O)O - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキルである]

から出発して調製する方法であって、

a) 式 (II) の化合物は、極性溶媒に溶解または懸濁されている、

b) イオウ含有塩が前記溶液または懸濁液に加えられる、ここで、前記イオウ含有塩が、アルカリ金属もしくはアルカリ土類金属の亜硫酸塩、アルカリ金属もしくはアルカリ土類金属の亜硫酸水素塩、アルカリ金属もしくはアルカリ土類金属のチオン酸塩、アルカリ金属もしくはアルカリ土類金属の亜ジチオン酸塩またはアルカリ金属もしくはアルカリ土類金属のチオ硫酸塩である、

および

c) 該反応混合物は、還流下で、前記極性溶媒の沸点に相当する温度より低い温度に加熱される

ことを特徴とする、方法。

【請求項 2】

R<sup>1a</sup> から R<sup>1d</sup> が、水素、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - アルコキシ、フッ素、塩素、臭素およびトリフルオロメチルからなる群から、互いに独立して選択さ

れることを特徴とする、請求項 1 に記載の式 (I) の化合物を調製する方法。

【請求項 3】

$R^{1a}$  から  $R^{1d}$  が、水素、メトキシ、フッ素および塩素からなる群から、互いに独立して選択されることを特徴とする、請求項 1 または 2 に記載の式 (I) の化合物を調製する方法。

【請求項 4】

$R^2$  が、非置換または置換された ( $C_1 - C_6$ ) - アルキル、( $C_3 - C_7$ ) - シクロアルキル、ベンジルまたは  $CH_2 - C(O)O - (C_1 - C_6)$  - アルキルであって、置換基が、水素、( $C_1 - C_6$ ) - アルキルまたは ( $C_3 - C_7$ ) - シクロアルキルからなる群から、互いに独立して選択されることを特徴とする、請求項 1 から 3 のいずれかに記載の式 (I) の化合物を調製する方法。

【請求項 5】

極性溶媒が、水、( $C_1 - C_4$ ) アルコールまたは水と ( $C_1 - C_4$ ) アルコールとの混合物であることを特徴とする請求項 1 から 4 のいずれかに記載の、式 (I) の化合物を調製する方法。

【請求項 6】

イオウ含有塩が、亜硫酸水素ナトリウム、亜硫酸ナトリウム、チオン酸ナトリウム、亜ジチオン酸硫酸ナトリウムおよびチオ硫酸ナトリウムからなる群から選択されることを特徴とする、請求項 1 に記載の式 (I) の化合物を調製する方法。

【請求項 7】

イオウ含有塩が、亜硫酸ナトリウム、亜硫酸水素ナトリウムまたはそれらの混合物であることを特徴とする、請求項 6 に記載の式 (I) の化合物を調製する方法。

【請求項 8】

2 から 3 当量のイオウ含有塩を反応混合物に加えることを特徴とする、請求項 1 から 7 のいずれかに記載の式 (I) の化合物を調製する方法。

【請求項 9】

2 から 2.5 当量のイオウ含有塩を反応混合物に加えることを特徴とする、請求項 8 に記載の式 (I) の化合物を調製する方法。

【請求項 10】

反応混合物が、40 から個々の溶媒の還流温度までの範囲にある温度に加熱されることを特徴とする、請求項 1 から 9 のいずれかに記載の式 (I) の化合物を調製する方法。

【請求項 11】

反応温度が、それぞれ使用される溶媒の還流温度に相当することを特徴とする、請求項 10 に記載の式 (I) の化合物を調製する方法。

【請求項 12】

反応混合物の加熱を、1 から 48 時間の間攪拌しながら行うことを特徴とする、請求項 1 から 11 のいずれかに記載の、式 (I) の化合物を調製する方法。

【請求項 13】

反応混合物の加熱が 1 から 24 時間の間、好ましくは 2 から 12 時間の間、攪拌しながら行うことを特徴とする、請求項 12 に記載の式 (I) の化合物を調製する方法。

【請求項 14】

消泡剤または異なる消泡剤の混合物を反応混合物に加えることを特徴とする、請求項 1 から 13 のいずれかに記載の式 (I) の化合物を調製する方法。

【請求項 15】

式 (I) の反応生成物のろ過による単離前に、水、( $C_1 - C_4$ ) アルコールまたは水と ( $C_1 - C_4$ ) アルコールとの混合物からなる極性溶媒の群から選択される沈殿剤を反応混合物に加えることを特徴とする、請求項 1 から 14 のいずれかに記載の式 (I) の化合物を調製する方法。

【請求項 16】

反応完了後に、ろ過により反応生成物を単離することを特徴とする、請求項 1 から 15

のいずれかに記載の式 ( I ) の化合物を調製する方法。

【誤訳訂正 2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0013

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0013】

さらに好ましい実施形態において、イオウ含有塩は、アルカリ金属もしくはアルカリ土類金属の亜硫酸塩、アルカリ金属もしくはアルカリ土類金属の亜硫酸水素塩、アルカリ金属もしくはアルカリ土類金属のチオン酸塩 ( t h i o n i t e )、アルカリ金属もしくはアルカリ土類金属の亜ジチオン酸塩またはアルカリ金属もしくはアルカリ土類金属のチオ硫酸塩からなる群から選択される。

【誤訳訂正 3】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0029

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0029】

イオウ含有塩として特に好ましいものは、それぞれのナトリウム塩である。すなわち、イオウ含有塩は、亜硫酸水素ナトリウム、亜硫酸ナトリウム、チオン酸ナトリウム ( s o d i u m t h i o n i t e )、亜ジチオン酸硫酸ナトリウムおよびチオ硫酸ナトリウムからなる群から選択される。

【誤訳訂正 4】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0041

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0041】

最も好ましいイオウ含有塩は、亜硫酸水素ナトリウムまたは亜硫酸ナトリウムであり、両方の混合物もまた使用できる。

【誤訳訂正 5】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0044

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0044】

亜硫酸水素ナトリウムをイオウ含有塩として使用する場合、試薬と溶媒のこの組み合わせは、非常に高い収率につながるので、水が好ましい極性溶媒である。

【誤訳訂正 6】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0054

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0054】

7 - フルオロ - 1 , 3 - ジヒドロ - 2 H - インドール - 2 - オンの調製

7 - フルオロ - 3 - ( メチルスルファニル ) - 1 , 3 - ジヒドロ - 2 H - インドール - 2 - オン ( 270 . 5 g ) を、水 ( 2000 g ) に溶解し、亜硫酸水素ナトリウム ( 300 g ) と混合した。この混合物を加熱還流し、この過程において激しく攪拌した。2 . 25 時間後、混合物を 25 まで冷却し、吸い込みフィルターにおいてろ過によって単離した。それを水を用いて 2 回洗浄し ( 各回 500 g )、その後、減圧下 ( < 50 m b a r 、

50) で乾燥させた。これにより、7 - フルオロ - I , 3 - ジヒドロ - 2 H - インドール - 2 - オンを白い固体として得た ( 206 . 3 g 、収率 95 % ) 。

LC - MS : M + H = 152 ( 100 % ) 。

$^1\text{H}$  - NMR ( 400 MHz ,  $\text{CDCl}_3$  ) : ( ppm ) = 3 . 59 ( s , 2 H ) 、 6 . 94 - 7 . 04 ( m , 3 H ) 、 8 . 22 ( s , broad , H ) 。