

【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9月28日(2006.9.28)

【公開番号】特開2005-206610(P2005-206610A)

【公開日】平成17年8月4日(2005.8.4)

【年通号数】公開・登録公報2005-030

【出願番号】特願2005-112900(P2005-112900)

【国際特許分類】

C 0 7 D 311/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/352 (2006.01)

A 6 1 P 5/32 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 311/04

A 6 1 K 31/352

A 6 1 P 5/32

C 0 7 M 7:00

【手続補正書】

【提出日】平成18年8月11日(2006.8.11)

【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

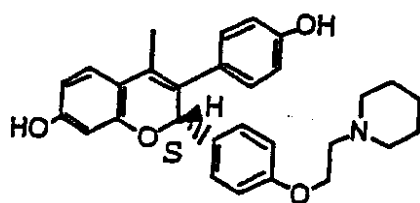
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式XIVの化合物を調製するための方法であって：

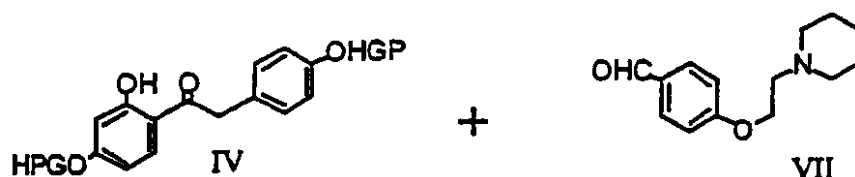
【化1】



XIV

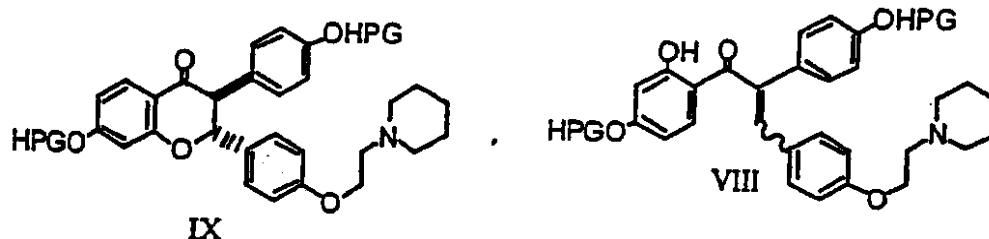
ここで、該方法は、式IVの化合物を式VIIで表される化合物：

【化2】



と、ピペリジン、ヒンダード有機アミン塩基および(C₃ - C₆)アルカノールの存在下、式IXの化合物のcis-異性体を含まず、そして式VIIのEおよびZカルコン：

【化 3】



を含まずに、化学的に純粋な式 I X の化合物が生成するのに十分な温度および時間で、反応させる工程を包含し、ここで、H P G は酸に不安定なフェノールヒドロキシル保護基である、方法。

【請求項 2】

前記 (C₃ - C₆) アルカノールが、2-ブタノール、イソプロパノールまたはイソブタノールである、請求項 1 に記載の方法。

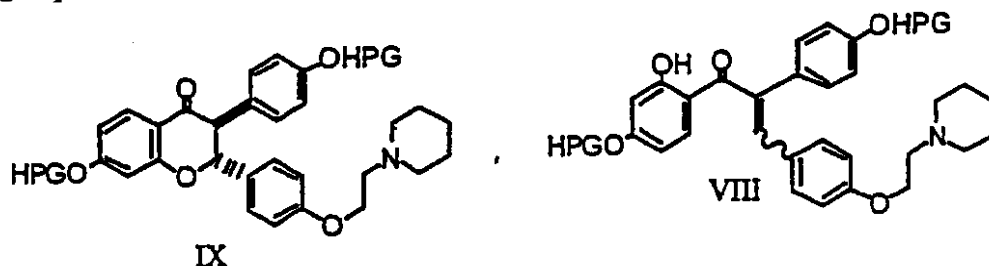
【請求項 3】

前記ヒンダード有機アミン塩基が、1, 8-ジアザビシクロ [5. 4. 0] ウンデクー 7-エン、または 1, 5-ジアザビシクロ [4. 3. 0] ノン-5-エンである、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 4】

請求項 1 に記載の方法であって、ここで (a) 前記式 I V の化合物は、ピペリジンおよび 2-ブタノールの存在下、2-ブタノールの沸点で、2-ブタノールと水との共沸混合物を完全に蒸留するのに十分な時間、式 V I I の化合物と接触され、式 V I I I の E および Z カルコンと、*c i s* および *t r a n s* I X との混合物を含有する反応生成物を形成し、そして (b) 該反応混合物は、20 ~ 25 °C の範囲の温度まで冷却され、前記ヒンダード有機アミノ塩基である、1, 8-ジアザビシクロ [5. 4. 0] ウンデクー 7-エンが添加され、該接触が、式 V I I I の E および Z カルコンを含有せず、かつ式 I X の化合物の *c i s*-異性体：

【化 4】



を含有せずに、式 I X の化合物を生成するのに十分な時間続けられる、方法。

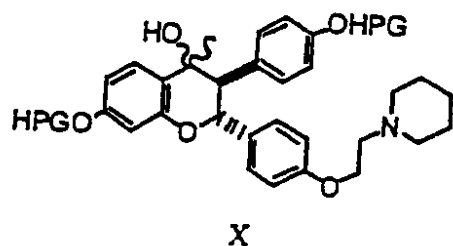
【請求項 5】

前記酸に不安定なフェノールヒドロキシル保護基がテトラヒドロピラニルである、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 6】

前記式 I X の化合物を、溶媒としての無水非環式エーテル中の化学量論的に過剰なメチルリチウムと、式 X の化合物：

【化 5】

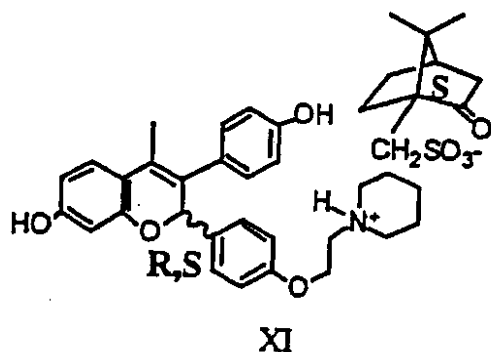


が生成するのに十分な時間および温度で、反応させる工程をさらに包含する、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 7】

請求項 6 に記載の方法であって、該方法は、前記式 X の化合物を、化学量論的に過剰な (S) - (+) - カンファースルホン酸と、エタノールを含む溶媒中で、式 X I の R, S / S, S ジアステレオマー酸付加塩：

【化 6】

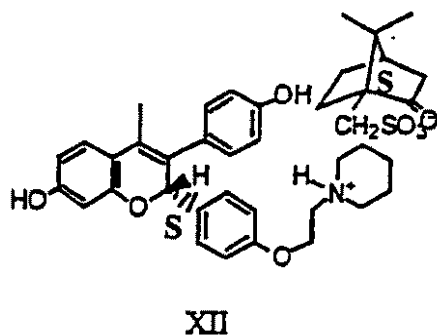
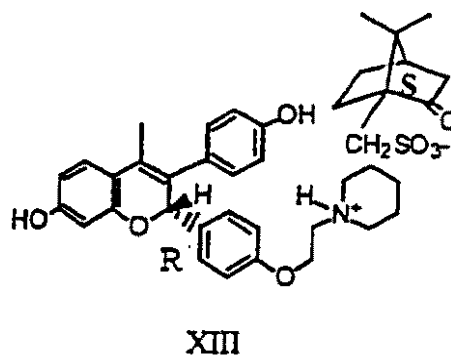


が生成するのに十分な時間およびそれに十分な温度で接触させる工程をさらに包含する、方法。

【請求項 8】

請求項 7 に記載の方法であって、該方法が、前記式 X I のジアステレオマー酸付加塩を、触媒量の (S) - (+) - カンファースルホン酸と、エタノールを含む溶媒中で、式 X I I の R, S - ジアステレオマー酸付加塩を含まずに、式 X I I の S, S - ジアステレオマー塩：

【化 7】



が生成するのに十分な時間および温度で接触させる工程をさらに包含する、方法。