

【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17年1月20日(2005.1.20)

【公表番号】特表2004-500303(P2004-500303A)

【公表日】平成16年1月8日(2004.1.8)

【年通号数】公開・登録公報2004-001

【出願番号】特願2000-517942(P2000-517942)

【国際特許分類第7版】

C 0 7 C 49/753

C 0 7 B 53/00

C 0 7 C 43/23

C 0 7 C 45/45

C 0 7 C 49/255

C 0 7 C 405/00

C 0 7 D 307/46

C 0 7 D 333/16

C 0 7 D 333/32

// A 6 1 K 31/5578

A 6 1 P 1/04

A 6 1 P 7/02

A 6 1 P 11/08

【F I】

C 0 7 C 49/753 C

C 0 7 B 53/00 G

C 0 7 B 53/00 B

C 0 7 C 43/23 A

C 0 7 C 45/45

C 0 7 C 49/255 Z

C 0 7 C 405/00 5 0 1 P

C 0 7 D 307/46

C 0 7 D 333/16

C 0 7 D 333/32

A 6 1 K 31/5578

A 6 1 P 1/04

A 6 1 P 7/02

A 6 1 P 11/08

【手続補正書】

【提出日】平成13年1月29日(2001.1.29)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】特許請求の範囲

【補正方法】変更

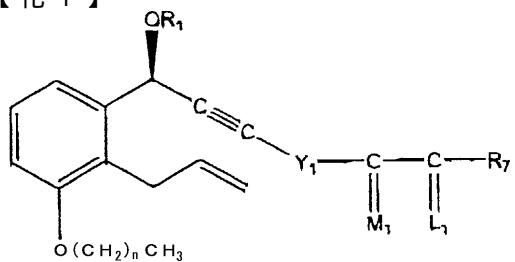
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

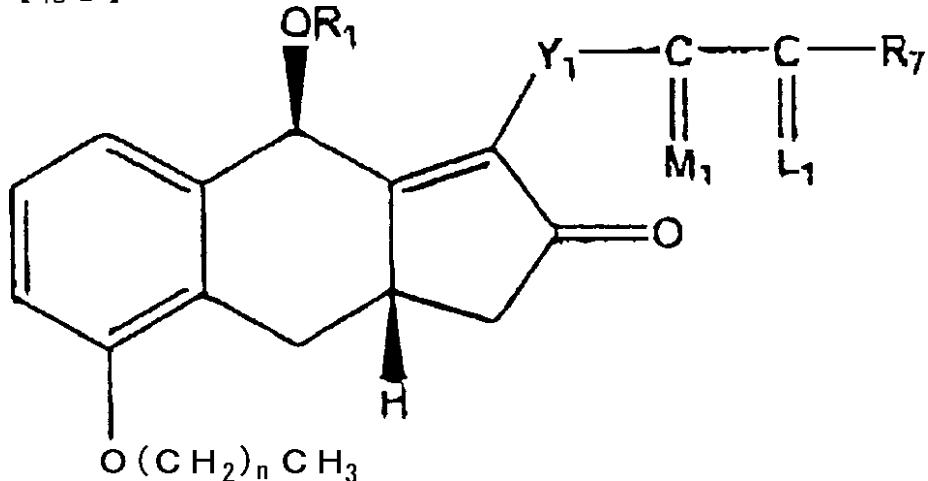
式:

【化1】



の開始化合物を次式：

【化2】

の化合物へと環化することを含む、9-デオキシ-PGF₁型化合物の製造方法において、式中ZがO、S、CH₂またはNR₈であり、R₈がH、アルキルまたはアリールであり；XがH、CN、OR₉またはCOOR₉であり、R₉がアルキル、THP、またはTBDMSであり；

nが0、1、2または3であり；

Y₁がトランス-CH=CH-、シス-CH=CH-、-CH₂(CH₂)_m-、または-C-C-であり；mが1、2または3であり；R₁がアルコール保護基であり；R₇が(1)-C_pH_{2p}-CH₃、その際のpは1から5までの整数である、(2)1、2または3個のクロロ、フルオロ、トリフルオロメチル、(C₁-C₃)アルキルまたは(C₁-C₃)アルコキシで置換されていてもよい、フェノキシ、但し、アルキル以外の置換基は2個より多くてはならず、但し、R₃及びR₄が同一または異なって、水素またはメチルの場合に限り、R₇はフェノキシまたは置換されたフェノキシである、(3)芳香族環が1、2または3個のクロロ、フルオロ、トリフルオロメチル、(C₁-C₃)アルキルまたは(C₁-C₃)アルコキシで置換されていてもよい、フェニル、ベニジル、フェニルエチルまたはフェニルプロピル、但し、アルキル以外の置換基は2個より多くてはならない、(4)シス-CH=CH-CH₂-CH₃、(5)-(CH₂)₂-CH(OH)-CH₃、または(6)-(CH₂)₃-CH=CH(CH₃)₂であり；-C(L₁)-R₇が、一緒になって(1)1から3個の(C₁-C₅)アルキルで置換されていてもよい(C₄-C₇)シクロアルキル、

- (2) 2-(2-フリル)エチル、
 (3) 2-(3-チエニル)エトキシ、または
 (4) 3-チエニルオキシメチルであり；

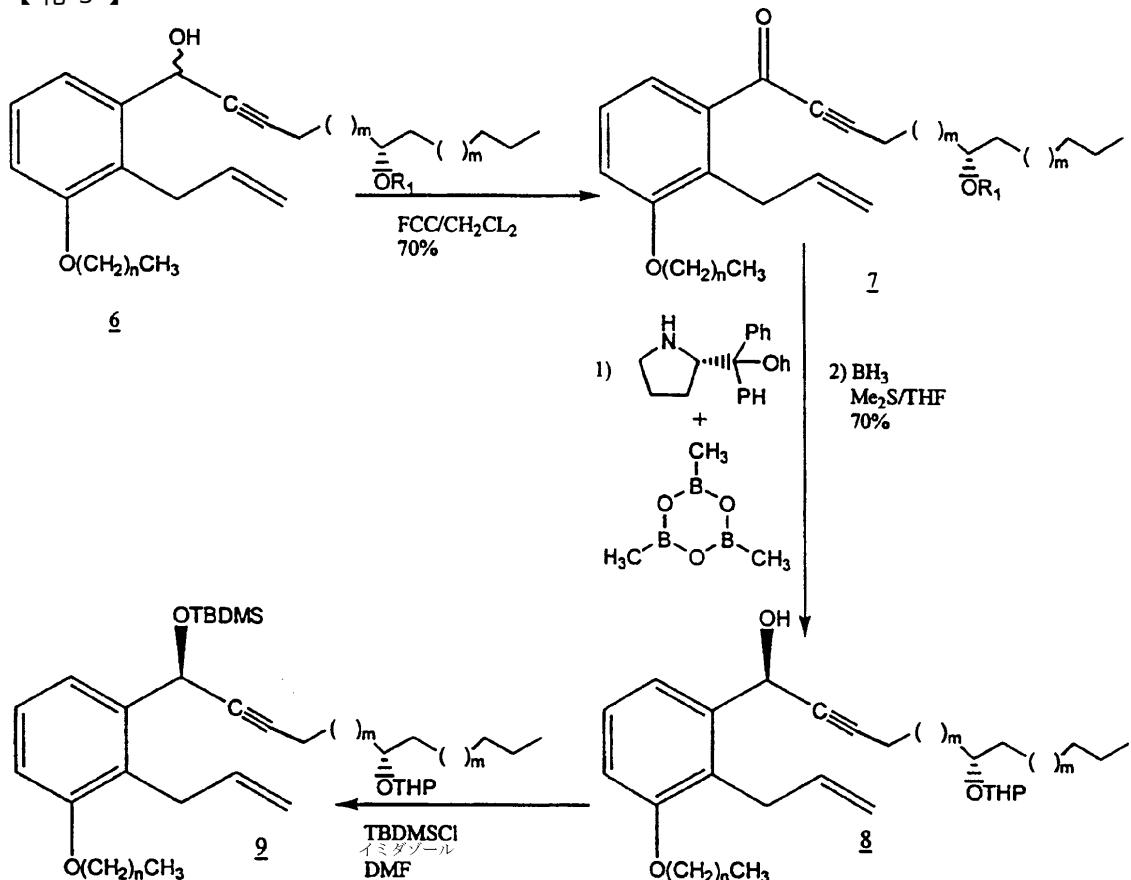
M_1 が $-OH$: $-R_5$ 、 $-R_5$: $-OH$ 、 $-OR_1$: $-R_5$ 、または $-R_5$: $-OR_1$ であり、その際の R_5 は水素またはメチルであり、 R_1 はアルコール保護基であり；且つ

L_1 が $-R_3$: $-R_4$ 、 $-R_4$: $-R_3$ 、または、 $-R_3$: $-R_4$ 及び $-R_4$: $-R_3$ の混合であり、その際の R_3 および R_4 は、同一または異なって、水素、メチルまたはフルオロであり、但し、 R_3 および R_4 の一方が水素またはフルオロの場合に限り、もう一方はフルオロである方法。

【請求項 2】

次のステップ：

【化 3】

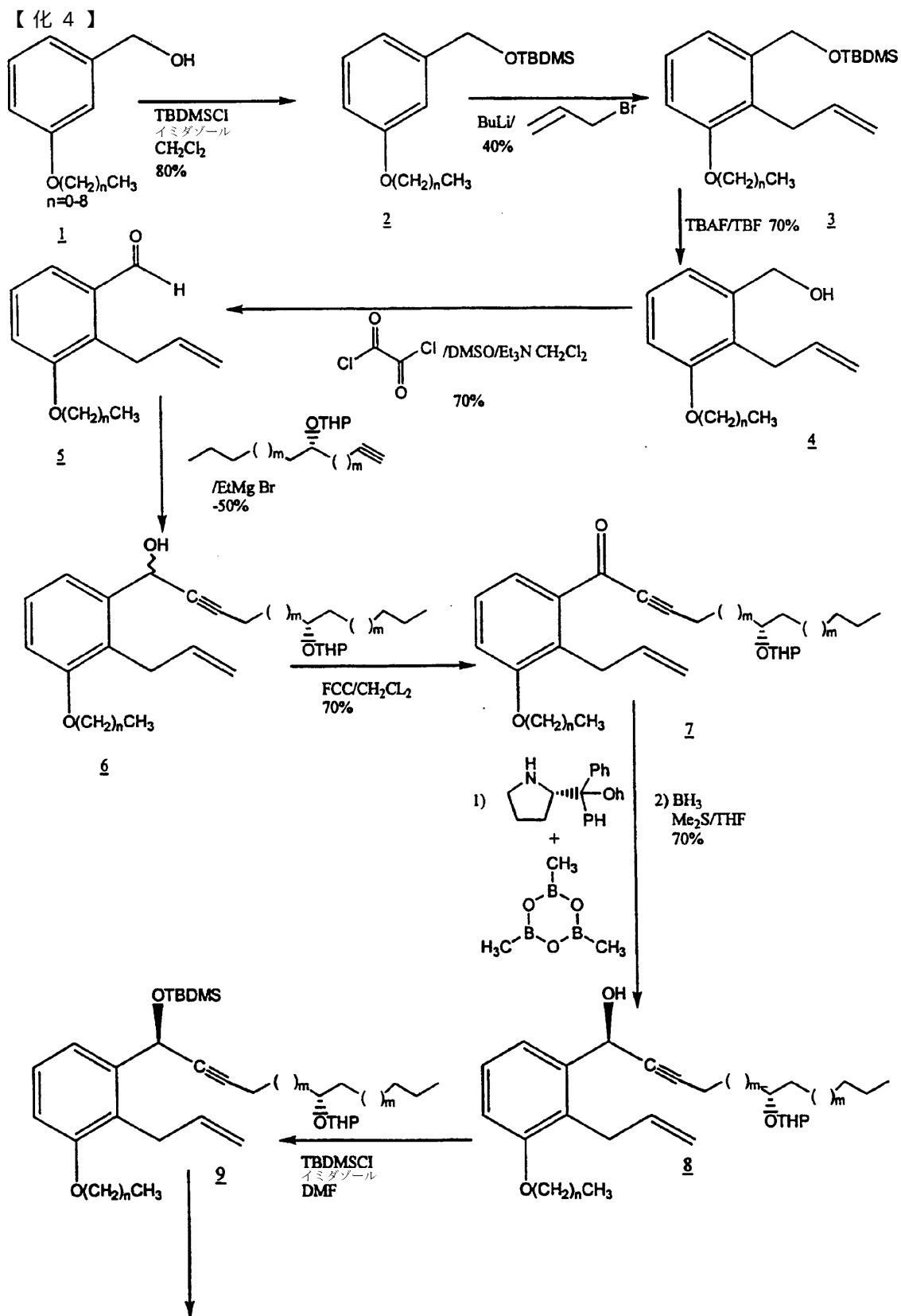


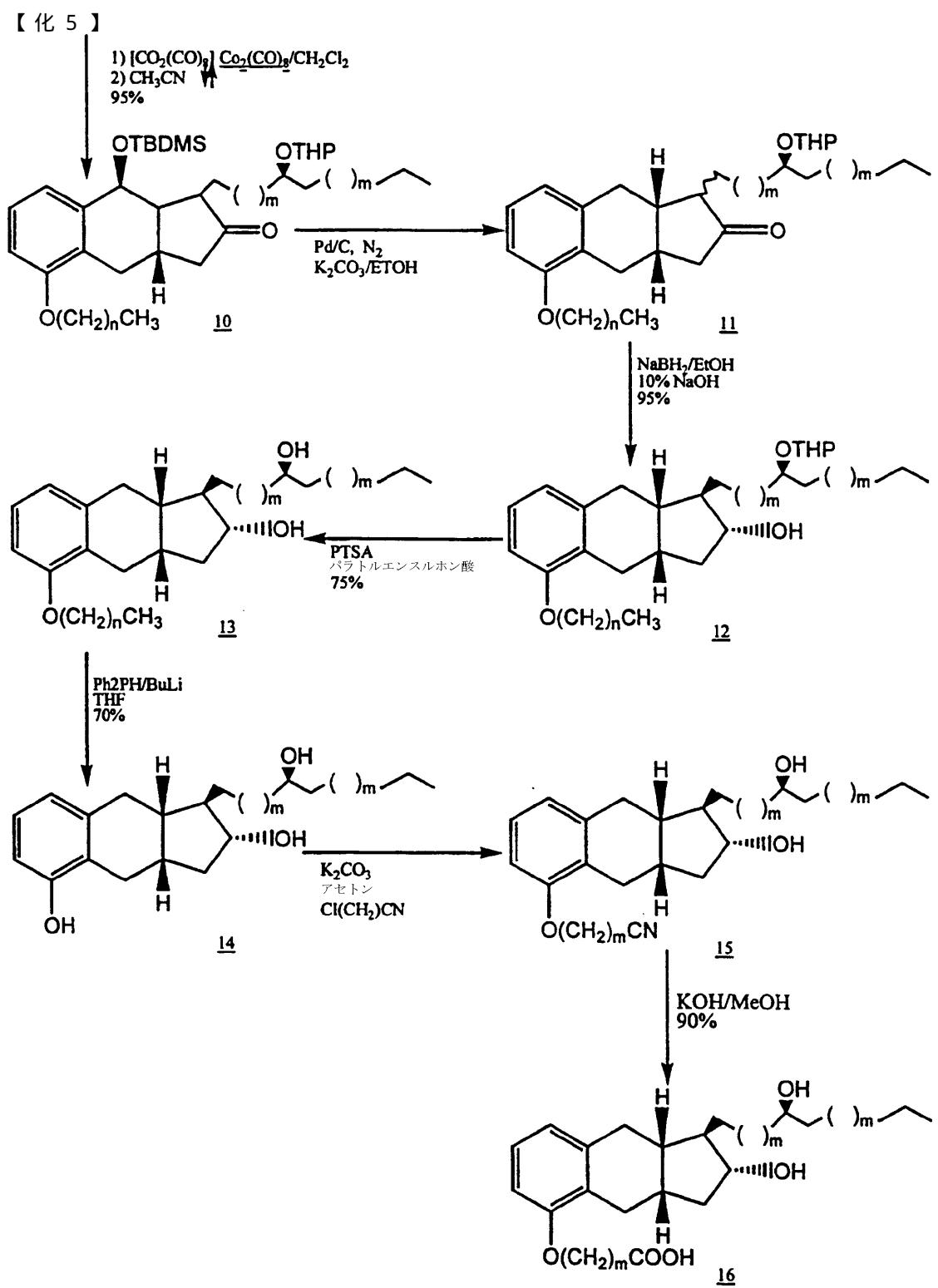
をさらに含み、その際、

式中 R_1 が独立して選ばれたアルコール保護基であり、 m が 1、2 または 3 であり、及び、 n が 0、1、2 または 3 である、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 3】

次のステップ：





を含む、請求項2に記載の方法。

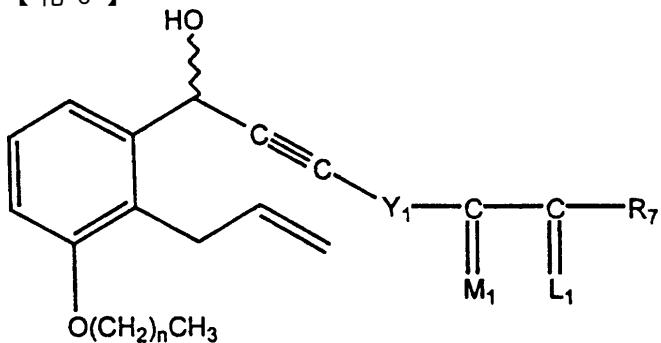
【請求項4】

m が1であり、及び n が0である、請求項3に記載の方法。

【請求項5】

式：

【化6】



で表され、

式中 Y_1 がトランス - $CH=CH-$ 、シス - $CH=CH-$ 、 - $CH_2-(CH_2)_m-$ 、または - $C=C-$ であり ; m が 1 、 2 または 3 であり ;

n が 0 、 1 、 2 または 3 であり ;

R_7 が

(1) - $C_pH_2p-CH_3$ 、その際の p は 1 から 5 までの整数である、

(2) 1 、 2 または 3 個のクロロ、フルオロ、トリフルオロメチル、(C_1-C_3) アルキルまたは(C_1-C_3) アルコキシで置換されていてもよい、フェノキシ、但し、アルキル以外の置換基は 2 個より多くてはならず、但し、 R_3 及び R_4 が同一または異なって、水素またはメチルの場合に限り、 R_7 はフェノキシまたは置換されたフェノキシである、

(3) 芳香族環が 1 、 2 または 3 個のクロロ、フルオロ、トリフルオロメチル、(C_1-C_3) アルキルまたは(C_1-C_3) アルコキシで置換されていてもよい、フェニル、ベンジル、フェニルエチルまたはフェニルプロピル、但し、アルキル以外の置換基は 2 個より多くてはならない、

(4) シス - $CH=CH-CH_2-CH_3$ 、

(5) - $(CH_2)_2-CH(OH)-CH_3$ 、または

(6) - $(CH_2)_3-CH=CH(CH_3)_2$ であり ;

- $C(L_1)-R_7$ が、一緒になって

(1) 1 から 3 個の(C_1-C_5) アルキルで置換されていてもよい(C_4-C_7) シクロアルキル、

(2) 2 - (2 - フリル) エチル、

(3) 2 - (3 - チエニル) エトキシ、または

(4) 3 - チエニルオキシメチルであり ;

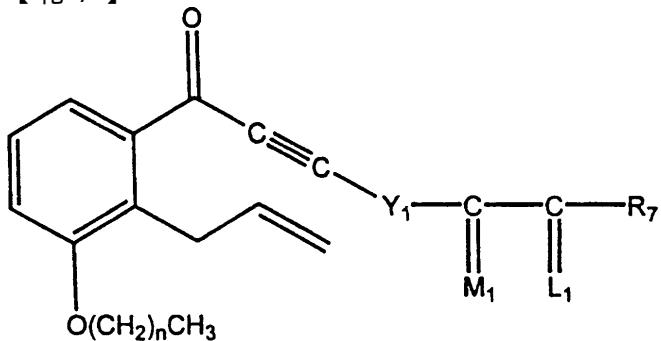
M_1 が - OH : - R_5 または - R_5 : - OH であり、その際の R_5 は水素またはメチルであり ;

L_1 が - R_3 : - R_4 、 - R_4 : - R_3 、または、 - R_3 : - R_4 及び - R_4 : - R_3 の混合であり、その際の R_3 及び R_4 は、同一または異なって、水素、メチルまたはフルオロであり、但し、 R_3 及び R_4 の一方が水素またはフルオロの場合に限り、もう一方はフルオロである化合物。

【請求項 6】

式 :

【化7】



で表され、

式中 Y_1 がトランス - $CH=CH$ - 、シス - $CH=CH$ - 、 - $CH_2(CH_2)_m$ - 、または - $C=C$ - であり ; m が 1、2 または 3 であり ;

n が 0、1、2 または 3 であり ;

R_7 が

(1) - C_pH_2p - CH_3 、その際の p は 1 から 5 までの整数である、

(2) 1、2 または 3 個のクロロ、フルオロ、トリフルオロメチル、(C_1-C_3) アルキルまたは (C_1-C_3) アルコキシで置換されていてもよい、フェノキシ、但し、アルキル以外の置換基は 2 個より多くてはならず、但し、 R_3 及び R_4 が同一または異なって、水素またはメチルの場合に限り、 R_7 はフェノキシまたは置換されたフェノキシである、

(3) 芳香族環が 1、2 または 3 個のクロロ、フルオロ、トリフルオロメチル、(C_1-C_3) アルキルまたは (C_1-C_3) アルコキシで置換されていてもよい、フェニル、ベンジル、フェニルエチルまたはフェニルプロピル、但し、アルキル以外の置換基は 2 個より多くてはならない、

(4) シス - $CH=CH-CH_2-CH_3$ 、

(5) - $(CH_2)_2-CH(OH)-CH_3$ 、または

(6) - $(CH_2)_3-CH=CH(CH_3)_2$ であり ;

- $C(L_1)-R_7$ が、一緒になって

(1) 1 から 3 個の (C_1-C_5) アルキルで置換されていてもよい (C_4-C_7) シクロアルキル、

(2) 2 - (2 - フリル) エチル

(3) 2 - (3 - チエニル) エトキシ、または

(4) 3 - チエニルオキシメチルであり ;

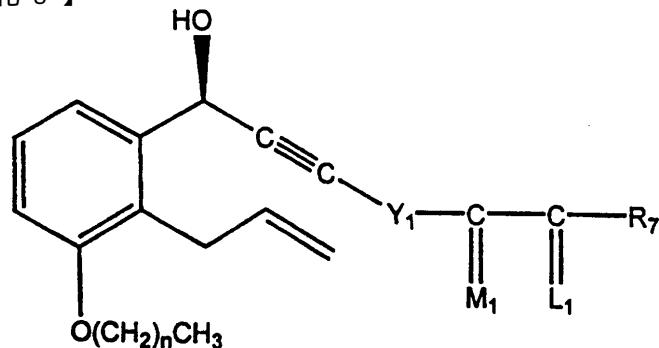
M_1 が - OH : - R_5 または - R_5 : - OH であり、その際の R_5 は水素またはメチルであり ;

L_1 が - R_3 : - R_4 、 - R_4 : - R_3 、または、 - R_3 : - R_4 及び - R_4 : - R_3 の混合であり、その際の R_3 及び R_4 は、同一または異なって、水素、メチル、またはフルオロであり、但し、 R_3 及び R_4 の一方が水素またはフルオロの場合に限り、もう一方はフルオロである化合物。

【請求項 7】

式 :

【化8】



で表され、

式中 Y_1 がトランス - $CH=CH-$ 、シス - $CH=CH-$ 、 $-CH_2(CH_2)_m-$ 、または $-C-C-$ であり ; m が 1、2 または 3 であり ;

n が 0、1、2 または 3 であり ;

R_7 が

(1) $-C_pH_2p-CH_3$ 、その際の p は 1 から 5 までの整数である、

(2) 1、2 または 3 個のクロロ、フルオロ、トリフルオロメチル、(C_1-C_3) アルキルまたは (C_1-C_3) アルコキシで置換されていてもよい、フェノキシ、但し、アルキル以外の置換基は 2 個より多くてはならず、但し、 R_3 及び R_4 が同一または異なって、水素またはメチルの場合に限り、 R_7 はフェノキシまたは置換されたフェノキシである、

(3) 芳香族環が 1、2 または 3 個のクロロ、フルオロ、トリフルオロメチル、(C_1-C_3) アルキルまたは (C_1-C_3) アルコキシで置換されていてもよい、フェニル、ベンジル、フェニルエチルまたはフェニルプロピル、但し、アルキル以外の置換基は 2 個より多くてはならない、

(4) シス - $CH=CH-CH_2-CH_3$ 、

(5) $-(CH_2)_2-CH(OH)-CH_3$ 、または

(6) $-(CH_2)_3-CH=CH(CH_3)_2$ であり ;

$-C(L_1)-R_7$ が、一緒になって

(1) 1 から 3 個の (C_1-C_5) アルキルで置換されていてよい (C_4-C_7) シクロアルキル、

(2) 2 - (2 - フリル) エチル、

(3) 2 - (3 - チエニル) エトキシ、または

(4) 3 - チエニルオキシメチルであり ;

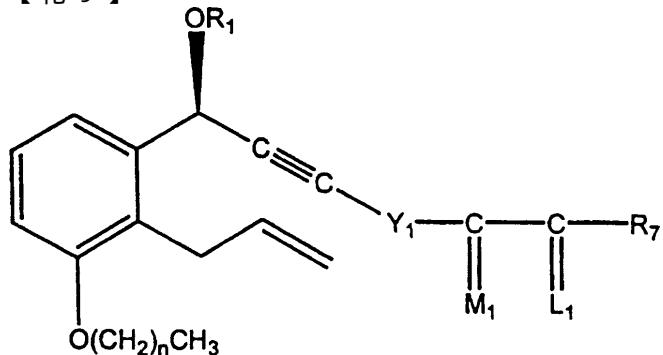
M_1 が $-OH : -R_5$ または $-R_5 : -OH$ であり、その際の R_5 は水素またはメチルであり ;

L_1 が $-R_3 : -R_4$ 、 $-R_4 : -R_3$ 、または、 $-R_3 : -R_4$ 及び $-R_4 : -R_3$ の混合であり、その際の R_3 および R_4 は、同一または異なって、水素、メチルまたはフルオロであり、但し、 R_3 及び R_4 の一方が水素またはフルオロの場合に限り、もう一方はフルオロである化合物。

【請求項 8】

式 :

【化9】



で表され、

式中 R_1 がアルコール保護基であり；

n が 0、1、2、または 3 であり；

Y_1 がトランス- $CH=CH-$ 、シス- $CH=CH-$ 、- $CH_2(CH_2)_m-$ 、または- $CC-$ であり； m が 1、2 または 3 であり；

R_7 が

(1) - C_pH_2p- CH_3 、その際の p は 1 から 5 までの整数である、

(2) 1、2 または 3 個のクロロ、フルオロ、トリフルオロメチル、(C_1-C_3) アルキルまたは (C_1-C_3) アルコキシで置換されていてもよい、フェノキシ、但し、アルキル以外の置換基は 2 個より多くてはならず、但し、 R_3 及び R_4 が同一または異なって、水素またはメチルの場合に限り、 R_7 はフェノキシまたは置換されたフェノキシである、

(3) 芳香族環が 1、2 または 3 個のクロロ、フルオロ、トリフルオロメチル、(C_1-C_3) アルキルまたは (C_1-C_3) アルコキシで置換されていてもよい、フェニル、ベンジル、フェニルエチルまたはフェニルプロピル、但し、アルキル以外の置換基は 2 個より多くてはならない、

(4) シス- $CH=CH-CH_2-CH_3$ 、

(5) - $(CH_2)_2-CH(OH)-CH_3$ 、または

(6) - $(CH_2)_3-CH=C(CH_3)_2$ であり；

- $C(L_1)-R_7$ が、一緒になって

(1) 1 から 3 個の (C_1-C_5) アルキルで置換されていてもよい (C_4-C_7) シクロアルキル、

(2) 2-(2-フリル)エチル、

(3) 2-(3-チエニル)エトキシ、または

(4) 3-チエニルオキシメチルであり；

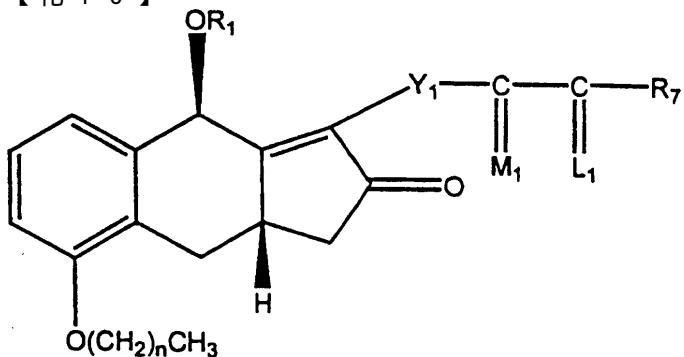
M_1 が - OH : - R_5 または - R_5 : - OH であり、その際の R_5 は水素またはメチルであり；

L_1 が - R_3 : - R_4 、- R_4 : - R_3 、または、- R_3 : - R_4 及び - R_4 : - R_3 の混合であり、その際の R_3 および R_4 は、同一または異なって、水素、メチルまたはフルオロであり、但し、 R_3 及び R_4 の一方が水素またはフルオロの場合に限り、もう一方はフルオロである化合物。

【請求項 9】

式：

【化10】



で表され、

式中 R_1 がアルコール保護基であり；

n が 0、1、2 または 3 であり；

Y_1 がトランス- $CH=CH-$ 、シス- $CH=CH-$ 、 $-CH_2(CH_2)_m-$ 、または $-C-C-$ であり； m が 1、2 または 3 であり；

R_7 が

(1) $-C_pH_2p-CH_3$ 、その際の p は 1 から 5 までの整数である、

(2) 1、2 または 3 個のクロロ、フルオロ、トリフルオロメチル、(C_1-C_3) アルキルまたは(C_1-C_3) アルコキシで置換されていてもよい、フェノキシ、但し、アルキル以外の置換基は 2 個より多くてはならず、但し、 R_3 及び R_4 が同一または異なって、水素またはメチルの場合に限り、 R_7 はフェノキシまたは置換されたフェノキシである、

(3) 芳香族環が 1、2 または 3 個のクロロ、フルオロ、トリフルオロメチル、(C_1-C_3) アルキルまたは(C_1-C_3) アルコキシで置換されていてもよい、フェニル、ベンジル、フェニルエチルまたはフェニルプロピル、但し、アルキル以外の置換基は 2 個より多くてはならない、

(4) シス- $CH=CH_2-CH_3$ 、

(5) $-(CH_2)_2-CH(OH)-CH_3$ 、または

(6) $-(CH_2)_3-CH=C(CH_3)_2$ であり；

$-C(L_1)-R_7$ が、一緒になって

(1) 1 から 3 個の(C_1-C_5) アルキルで置換されていてもよい(C_4-C_7) シクロアルキル、

(2) 2-(2-フリル)エチル、

(3) 2-(3-チエニル)エトキシ、または

(4) 3-チエニルオキシメチルであり；

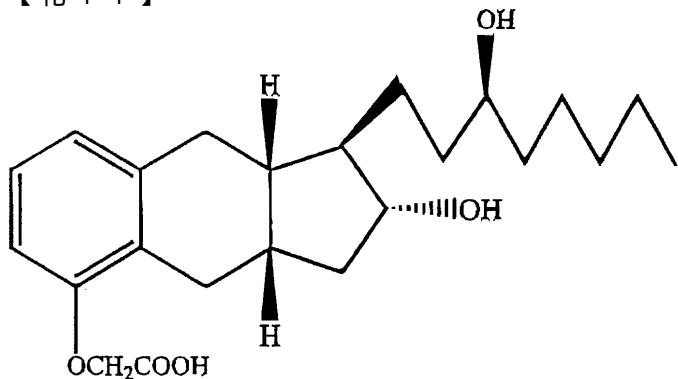
M_1 が $-OH : -R_5$ または $-R_5 : -OH$ であり、その際の R_5 は水素またはメチルであり；

L_1 が $-R_3 : -R_4$ 、 $-R_4 : -R_3$ 、または、 $-R_3 : -R_4$ 及び $-R_4 : -R_3$ の混合であり、その際の R_3 及び R_4 は、同一または異なって、水素、メチルまたはフルオロであり、但し、 R_3 及び R_4 の一方が水素またはフルオロの場合に限り、もう一方はフルオロである化合物。

【請求項10】

下記式で表される立体選択的に製造された異性体化合物。

【化 1 1】



【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

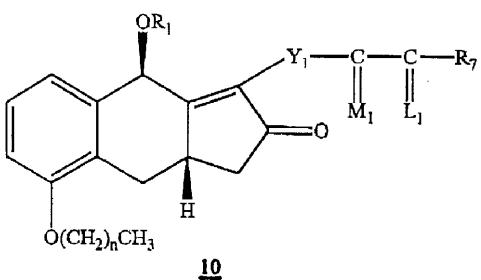
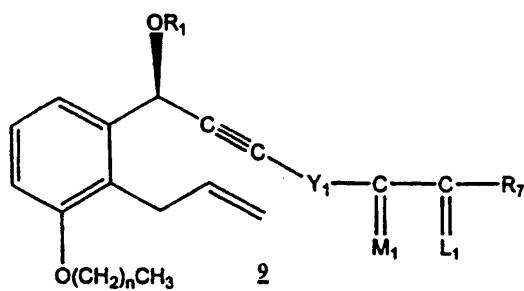
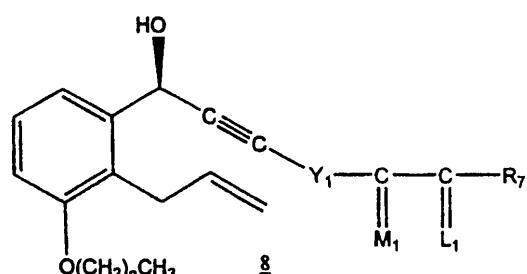
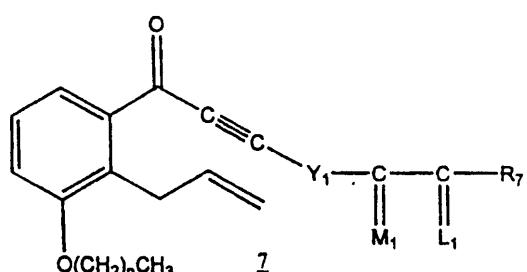
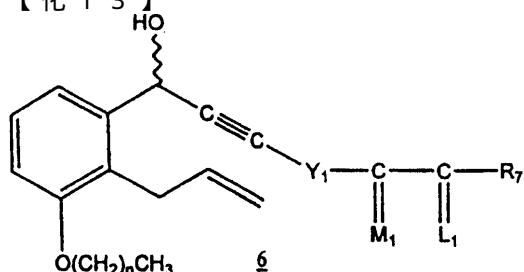
【補正対象項目名】0 0 1 3

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 1 3】

【化 1 3】



【手続補正 3】

【補正対象書類名】明細書

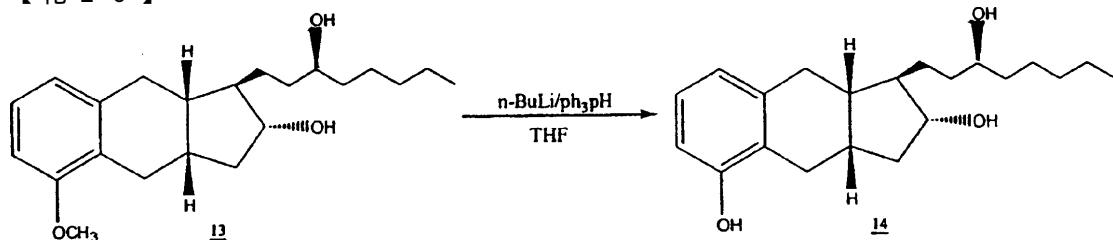
【補正対象項目名】0 0 4 3

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 4 3】

【化26】



【手続補正4】

【補正対象書類名】明細書

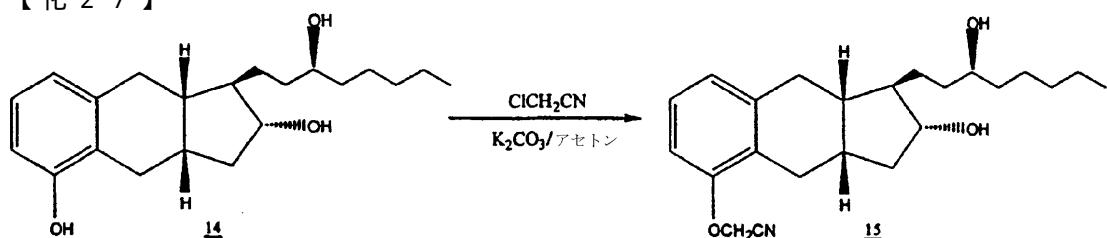
【補正対象項目名】0045

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0045】

【化27】



【手続補正5】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0047

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0047】

【化28】

