

【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 21 年 6 月 25 日 (2009.6.25)

【公表番号】特表 2007-509991 (P2007-509991A)

【公表日】平成 19 年 4 月 19 日 (2007.4.19)

【年通号数】公開・登録公報 2007-015

【出願番号】特願 2006-538556 (P2006-538556)

【国際特許分類】

C 07 D 207/34 (2006.01)

【F I】

C 07 D 207/34

【手続補正書】

【提出日】平成 21 年 4 月 30 日 (2009.4.30)

【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

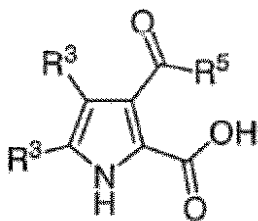
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I - a

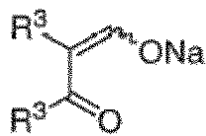
【化 1】



I-a

の化合物の製造方法であって：(a) 式 I V - a

【化 2】



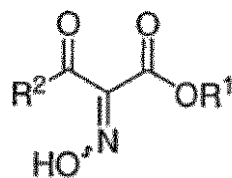
IV-a

〔式中、 R^3 は C_{1-12} 脂肪族、 C_{3-12} アルキル - 環状脂肪族、 C_{3-12} アルキル - アリール、 C_{3-12} アルキル - ヘテロアリール、または C_{3-12} アルキル - 環状脂肪族であり、

R^5 は、 C_{1-12} 脂肪族、アリール、ヘテロアリール、 C_{1-12} アルキル - 環状脂肪族、 C_{1-12} 脂肪族 - アリール、 C_{1-12} 脂肪族 - ヘテロアリール、または C_{1-12} 脂肪族 - 環状脂肪族である〕

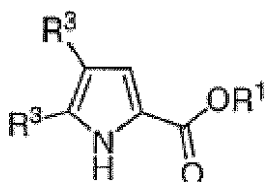
の化合物の水溶液を、式 V - a

【化 3】

**V-a**

〔式中、R¹ および R² は各々独立して C₁ - 6 脂肪族である〕
 の化合物と、垂鉛、ジオキサン、水、および所望によりさらなる好適な溶媒の存在下で混合して、式 V I

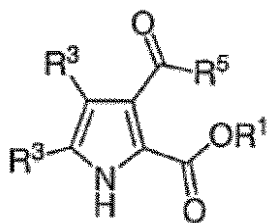
【化 4】

**V I**

の化合物を形成すること、

(b) 式 V I の化合物を好適なアシル化剤でアシル化し、式 I X

【化 5】

**I X**

の化合物を形成すること：そして

(c) 式 I X の化合物を好適な加水分解条件下で加水分解して、式 I - a
 の化合物を形成することを含んでなる方法。

【請求項 2】

式 V I の化合物を R⁵ - X または R⁵ C (= O) - O - C (= O) R⁵ と反応させて、式 I X

〔式中、

X は好適な脱離基であり；

R⁵ は C₁ - 12 脂肪族、アリール、ヘテロアリール、C₁ - 12 脂肪族 - 環状脂肪族、C₁ - 12 脂肪族 - アリール、C₁ - 12 脂肪族 - ヘテロアリール、または C₁ - 12 脂肪族 - 環状脂肪族である〕

の化合物を形成する、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 3】

前記アシル化条件が：

化合物を AlCl₃ および R⁵ C (= O) - O - C (= O) R⁵ と加熱して、式 I X の化合物を形成することを含む、請求項 2 に記載の方法。

【請求項 4】

前記アシル化条件が：

化合物を AlCl₃ および Ac₂O と還流ジクロロメタン中で加熱して、R⁵ がメチルである式 I X の化合物を形成することを含む、請求項 3 に記載の方法。

【請求項 5】

加水分解条件が：

好適な塩基、好適な溶媒、および 20 ~ 100 の反応温度を含む、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 6】

前記塩基が $M(OH)_n$ (式中、M はリチウム、ナトリウム、カリウム、セシウム、マグネシウム、およびカルシウムから選択される金属であり、n は 1 ~ 2 である) である、請求項 5 に記載の方法。

【請求項 7】

前記溶媒がアルコール溶媒である、請求項 6 に記載の方法。

【請求項 8】

前記塩基が KOH であり、溶媒が EtOH であり、そして温度がエタノールの還流温度である、請求項 7 に記載の方法。

【請求項 9】

式 I V の化合物、式 V の化合物、および好適な酸を水および好適な体積の有機溶媒中で反応させて、反応混合物を溶液中に保つ、請求項 1 - 8 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 10】

式 I V の化合物、式 V の化合物、および酢酸を好適な体積の水およびジオキサン中で反応させて、反応の内部温度を約 50 ~ 約 80 に維持する、請求項 1 - 8 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 11】

式 I V の化合物、式 V の化合物、水、ジオキサン、および酢酸を約 50 ~ 約 65 にて攪拌する、請求項 1 - 8 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 12】

前記反応混合物を約 58 ~ 約 60 にて攪拌する請求項 11 に記載の方法。

【請求項 13】

さらに亜鉛を加える工程を含む、請求項 1 - 8 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 14】

さらに混合物を約 75 ~ 約 85 にて攪拌する請求項 13 に記載の方法。

【請求項 15】

混合物を約 80 ~ 約 85 にて攪拌する請求項 14 に記載の方法。

【請求項 16】

混合物を約 80 ~ 約 82 にて攪拌する請求項 1 - 8 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 17】

亜鉛を少しずつ加える、請求項 1 - 8 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 18】

R^3 が各々独立して C_{1-6} アルキルである、請求項 1 - 8 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 19】

R^3 が各々独立して C_{1-3} アルキルである、請求項 18 に記載の方法。

【請求項 20】

R^3 が各々独立してメチルである、請求項 19 に記載の方法。

【請求項 21】

R^2 および R^3 が各々独立してメチルであり、そして R^1 がエチルである、請求項 1 - 8 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 22】

R^5 が C_{1-6} アルキルである、請求項 1 - 8 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 23】

R^5 がメチルである、請求項 1 - 8 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 24】

R^3 および R^5 が 各々 独立してメチルである、請求項 1 - 8 のいずれか 一項 に記載の方法。

【請求項 25】

R^2 、 R^3 、および R^5 が 各々 独立してメチルであり、そして R^1 がエチルである、請求項 24 に記載の方法。