

【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 25 年 5 月 2 日 (2013.5.2)

【公表番号】特表 2012-524769 (P2012-524769A)

【公表日】平成 24 年 10 月 18 日 (2012.10.18)

【年通号数】公開・登録公報 2012-042

【出願番号】特願 2012-506579 (P2012-506579)

【国際特許分類】

C 0 7 D 401/12 (2006.01)

C 0 7 D 211/46 (2006.01)

C 0 7 C 257/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 401/12 C S P

C 0 7 D 211/46

C 0 7 C 257/12

A 6 1 K 31/506

A 6 1 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成 25 年 3 月 13 日 (2013.3.13)

【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】

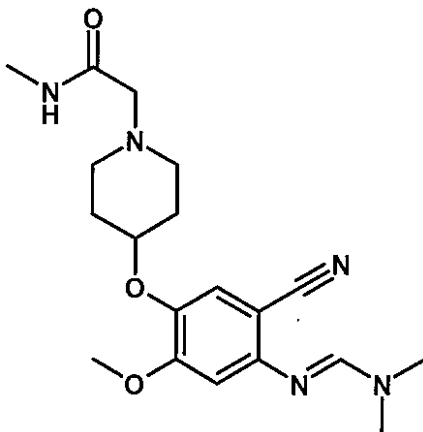
【特許請求の範囲】

【請求項 1】

4 - (3 - クロロ - 2 - フルオロアニリノ) - 7 - メトキシ - 6 - { [1 - (N - メチルカルバモイルメチル) ピペリジン - 4 - イル] オキシ } キナゾリンまたはその塩の製造方法であって：

(a) 式 (I I) の化合物：

【化 1】



II

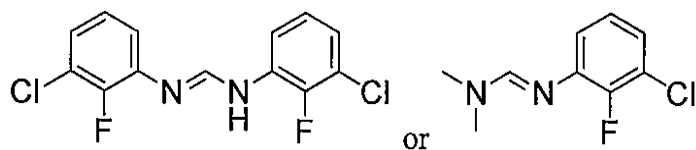
を適切な酸の存在下で 3 - クロロ - 2 - フルオロアニリンと反応させること；または

(b) 式 (I I I) の化合物：

CN(C)C(=O)CN1CCOCC1Oc2cc(C#N)c(N)c(OC)c2

III

【化 3】



XII

XII

を含む方法。

酸が酢酸、ブタン二酸、フマル酸またはプロパン酸である、請求項 1 に記載の方法。

式 (I I) の化合物が、式 (I I I) の化合物：

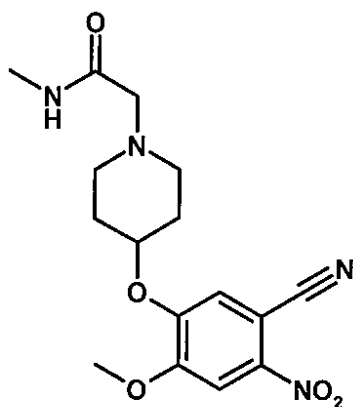
CNC(=O)CN1CCOCC1Oc2cc(N)c(C#N)c(OC)c2

III

【請求項 4】

式 (I I I) の化合物が、式 (I V) の化合物：

【化 5】



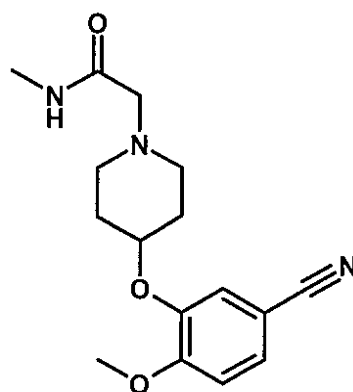
IV.

の還元を含む方法により製造される、請求項 1 または 3 に記載の方法。

【請求項 5】

式 (IV) の化合物が、式 (V) の化合物：

【化 6】



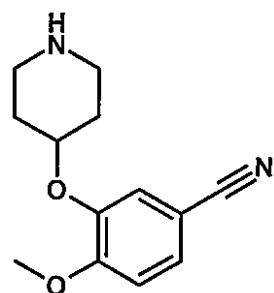
V.

のニトロ化を含む方法により製造される、請求項 4 に記載の方法。

【請求項 6】

式 (V) の化合物が、式 (VI) の化合物：

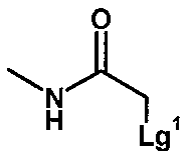
【化 7】



VI

を式 (VII) の化合物：

【化 8】



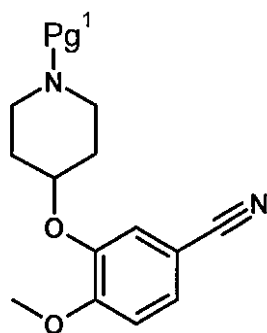
VII

(式中、 Lg^1 は適切な脱離基である) と反応させることを含む方法により製造される、請求項 5 に記載の方法。

【請求項 7】

式 (VI) の化合物が、式 (VIII) の化合物：

【化 9】



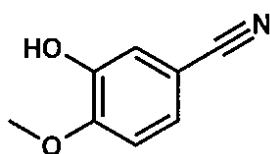
VIII

(式中、 Pg^1 は適切なアミノ保護基である) の脱保護を含む方法により製造される、請求項 6 に記載の方法。

【請求項 8】

式 (VIII) の化合物が、式 (X) の化合物：

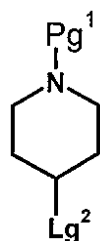
【化 10】



X

を式 (IX) の化合物：

【化 11】



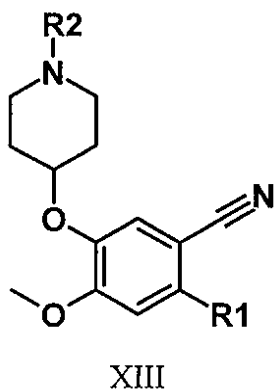
IX

(式中、 Lg^2 は適切な脱離基であり、 Pg^1 は適切なアミノ保護基である) と反応させることを含む方法により製造される、請求項 7 に記載の方法。

【請求項 9】

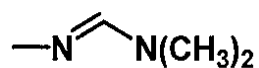
式 (XIII) の化合物またはその塩：

【化 12】



(式中、R1は、H、-NH₂、-NO₂、または

【化 13】



であり；

R2は、H、N-メチルカルバモイルメチル、またはPg¹であり；

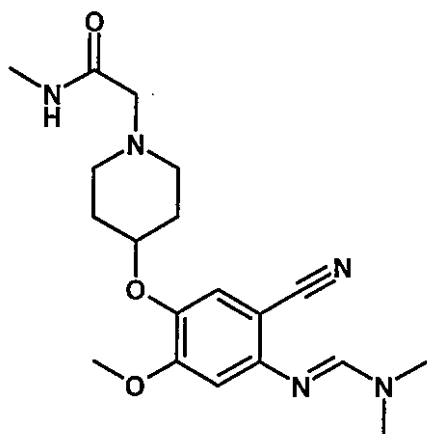
Pg¹は、アミノ保護基であり；

ただし、R2がHまたはアミノ保護基である場合はR1はHである）。

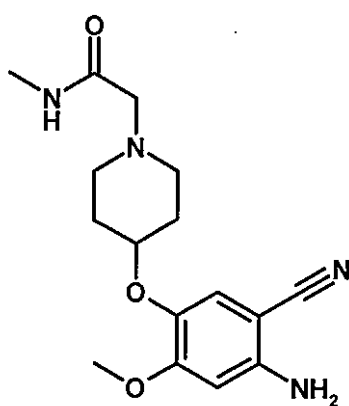
【請求項 10】

式 (II)、(III)、(IV)、(V)、(VI) および (VII) のいずれかの化合物から選択される、請求項 9 に記載の化合物：

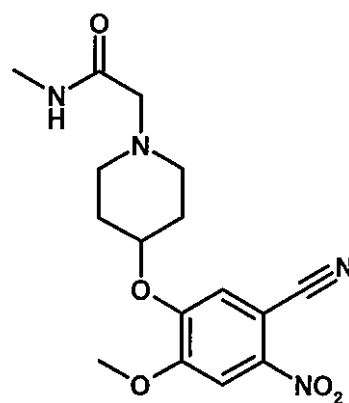
【化 1 4】



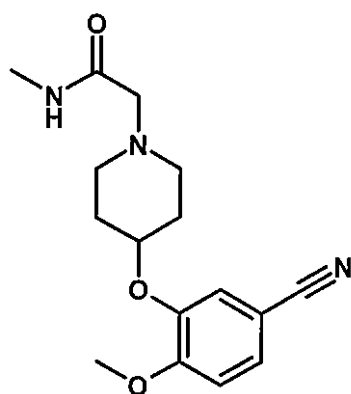
II



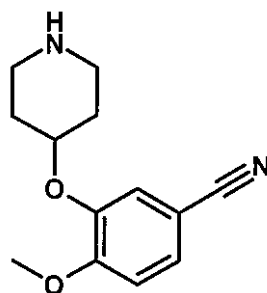
III



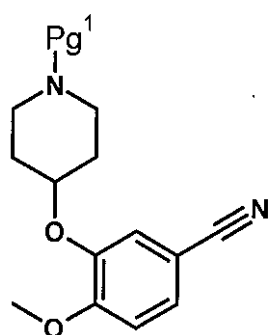
IV



V



VI

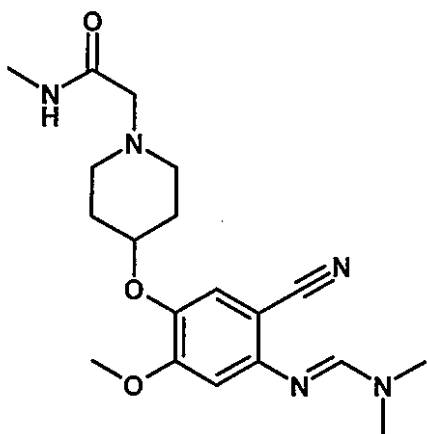


VIII

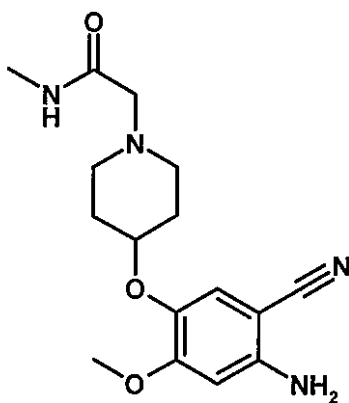
【請求項 1 1】

式 (I I)、(I I I)、(I V)、(V)、(V I) および (V I I I) のいずれかの化合物の塩から選択される、請求項 9 に記載の化合物の塩：

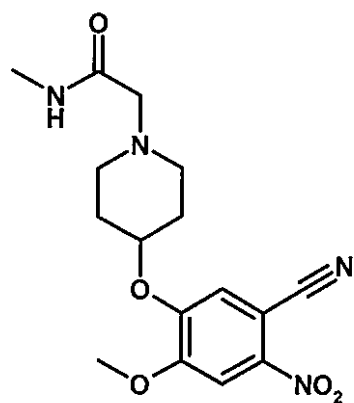
【化 1 5】



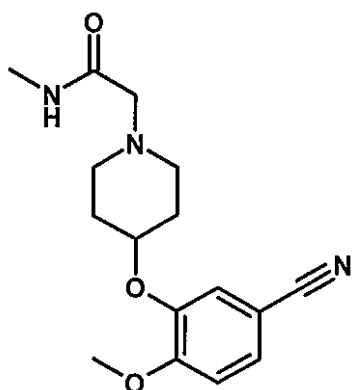
II



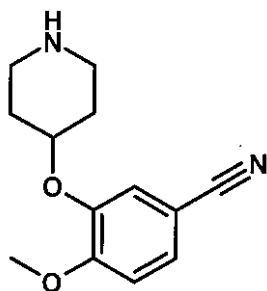
III



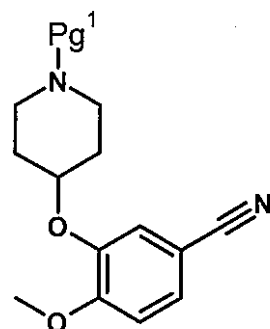
IV



V



VI

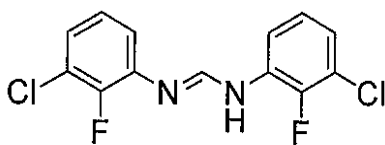


VIII

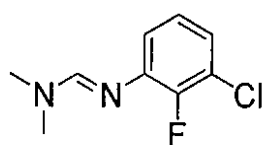
【請求項 1 2】

式 (X I)、式 (X I I) またはその塩から選択される化合物：

【化 1 6】



XI



XII

【請求項 1 3】

請求項 1 ～ 8 のいずれか 1 項に記載の方法により製造される化合物、または請求項 9 ～ 12 のいずれか 1 項に記載の化合物もしくはその塩を投与することを含む、治療方法。