

【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 07 D 401/12 (2006.01)

C 07 D 211/46 (2006.01)

C 07 C 257/12 (2006.01)

A 61 K 31/506 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

【F I】

C 07 D 401/12 C S P

C 07 D 211/46

C 07 C 257/12

A 61 K 31/506

A 61 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】

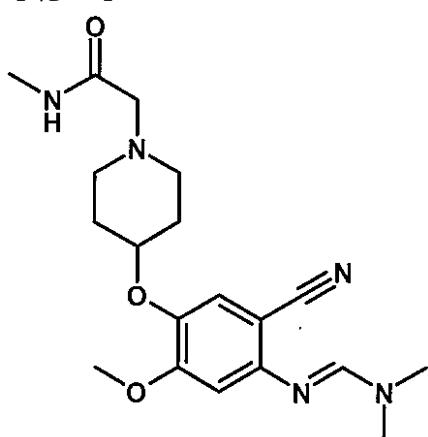
【特許請求の範囲】

【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】

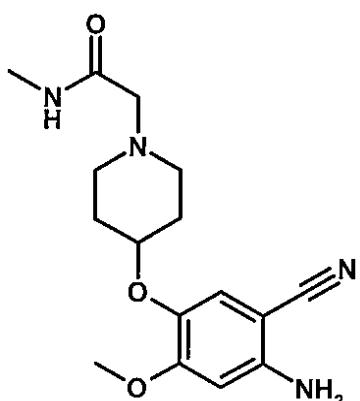


II

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：

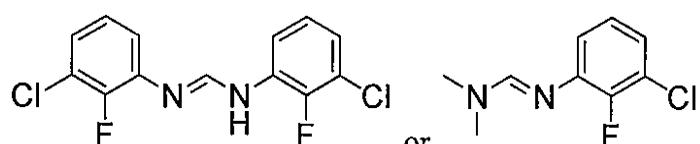
【化2】



III

を適切な酸の存在下で式(XI)または式(XII)の化合物：

【化3】



XI

XII

と反応させること；

を含む方法。

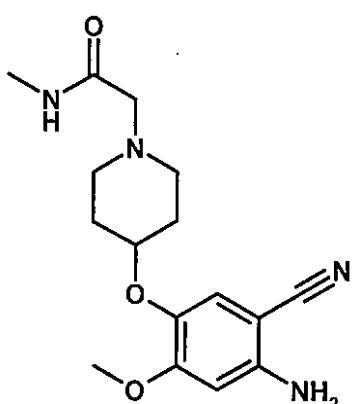
【請求項2】

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。

【請求項3】

式(III)の化合物が、式(IIII)の化合物：

【化4】



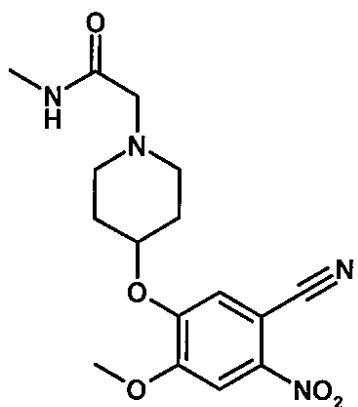
III

をN,N-ジメチルホルムアミドジメチルアセタールと反応させることを含む方法により
製造される、請求項1に記載の方法。

【請求項4】

式(IIII)の化合物が、式(IV)の化合物：

【化5】



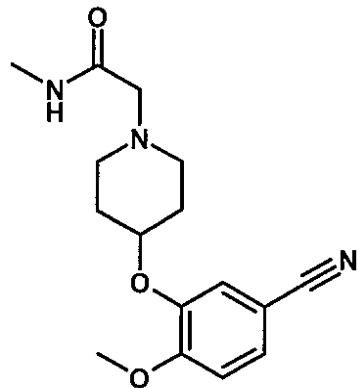
IV.

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】



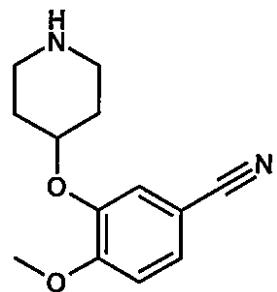
V.

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：

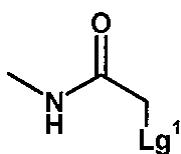
【化7】



VI

を式(VII)の化合物：

【化 8】



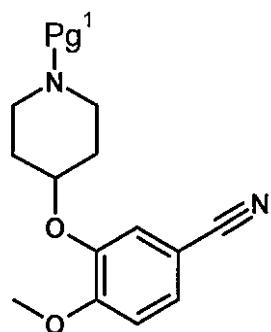
VII

(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(VII)の化合物：

【化 9】



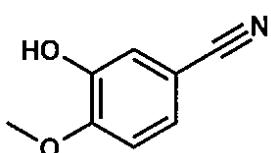
VIII

(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(VII)の化合物が、式(X)の化合物：

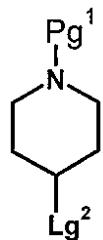
【化 10】



X

を式(I X)の化合物：

【化 11】



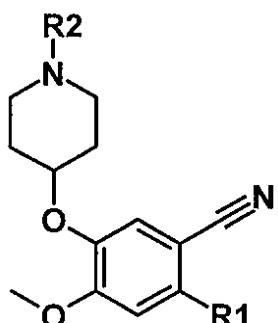
IX

(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】

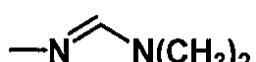
式 (XIII) の化合物またはその塩：

【化 1 2】



(式中、R1は、H、-NH₂、-NO₂、または

【化 1 3】



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；

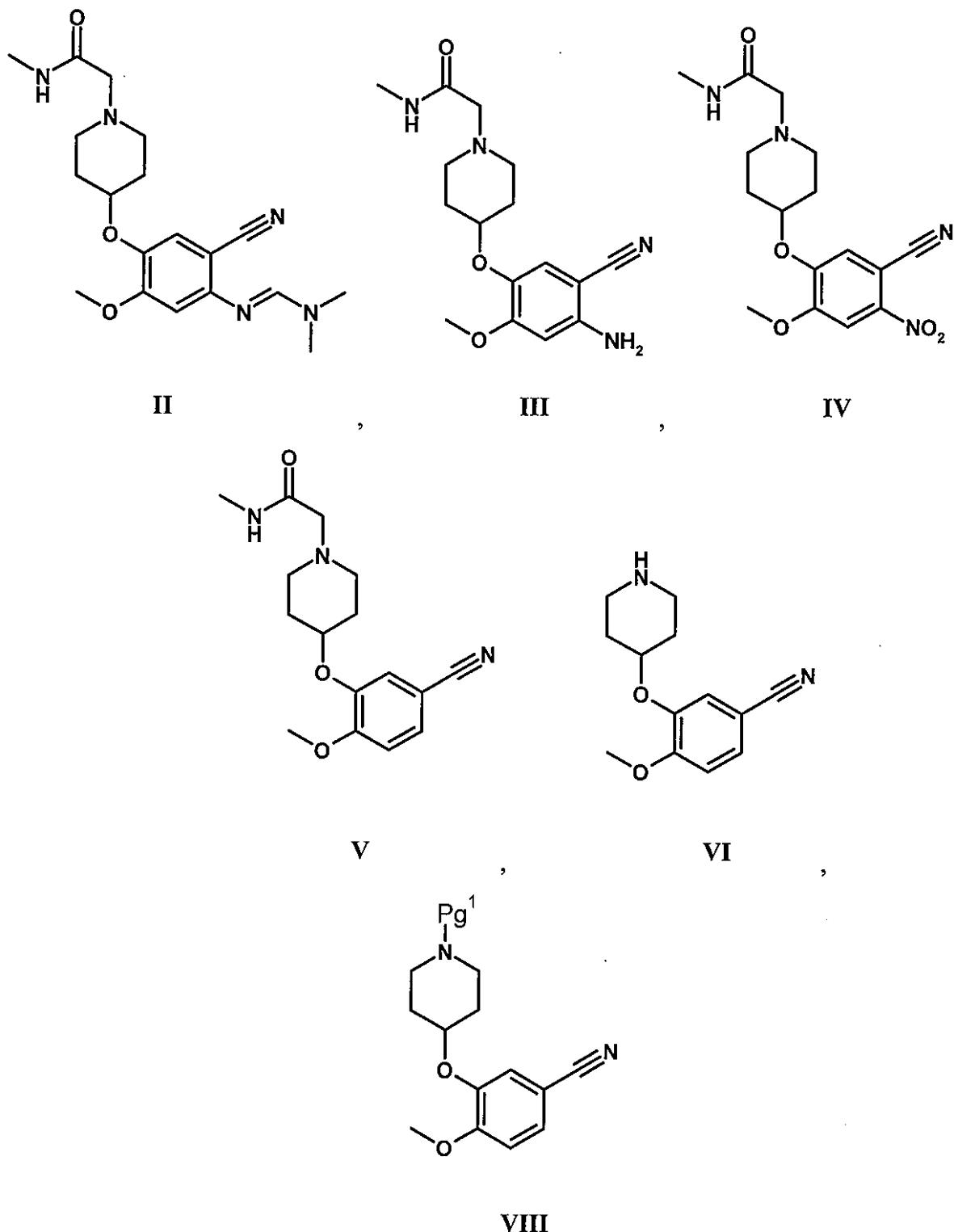
Pg¹は、アミノ保護基であり；

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(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から選択される、請求項9に記載の化合物：

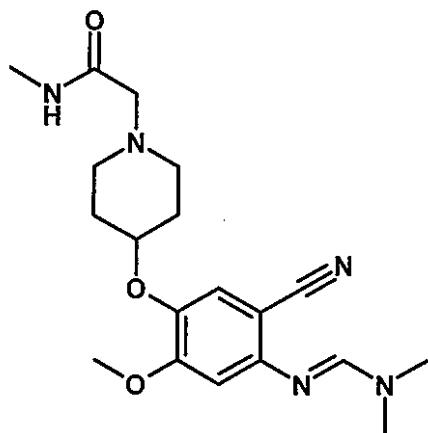
【化 14】



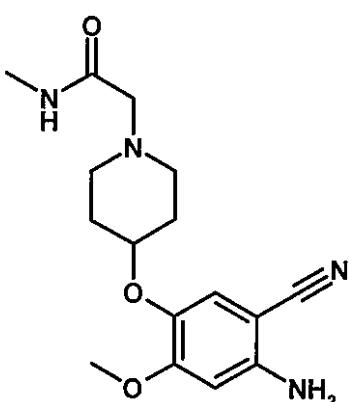
【請求項 11】

式(II)、(III)、(IV)、(V)、(VI)および(VII)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：

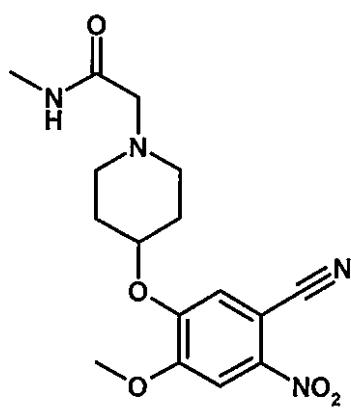
【化15】



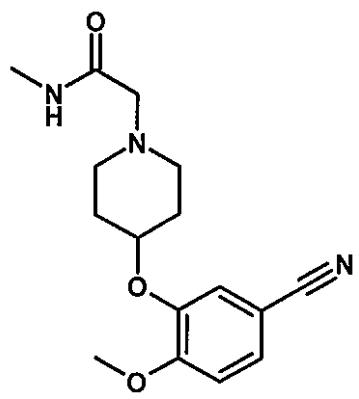
II



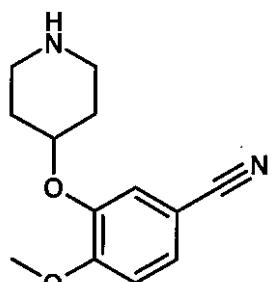
III



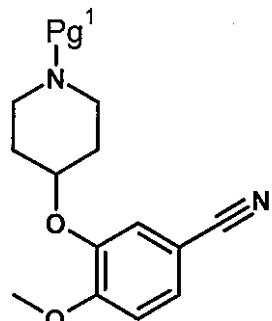
IV



V



VI

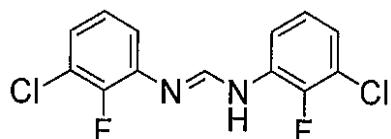


VIII

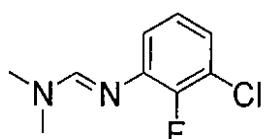
【請求項12】

式(XI)、式(XII)またはその塩から選択される化合物：

【化16】



XI



XII

【請求項13】

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。