

【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26年3月20日(2014.3.20)

【公表番号】特表2013-520413(P2013-520413A)

【公表日】平成25年6月6日(2013.6.6)

【年通号数】公開・登録公報2013-028

【出願番号】特願2012-553849(P2012-553849)

【国際特許分類】

C 07C 233/65	(2006.01)
C 07C 231/06	(2006.01)
C 07D 303/08	(2006.01)
C 07D 241/04	(2006.01)
C 07C 253/14	(2006.01)
C 07C 255/57	(2006.01)
C 07B 53/00	(2006.01)
C 07B 61/00	(2006.01)
A 61P 43/00	(2006.01)
A 61K 31/495	(2006.01)

【F I】

C 07C 233/65	C S P
C 07C 231/06	
C 07D 303/08	
C 07D 241/04	
C 07C 253/14	
C 07C 255/57	
C 07B 53/00	G
C 07B 61/00	3 0 0
A 61P 43/00	1 1 3
A 61K 31/495	

【手続補正書】

【提出日】平成26年1月31日(2014.1.31)

【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

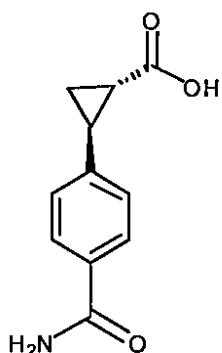
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式I a :

【化1】



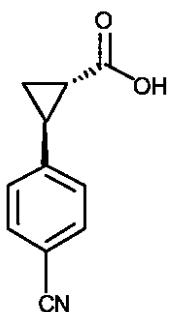
(Ia)

の化合物、又はその製薬学的に許容される塩。

【請求項2】

式IX：

【化2】



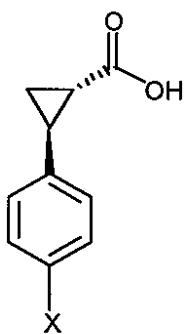
(IX)

の化合物を、塩基及び過酸化物と反応させ、次いで得られた混合物を酸性溶液と反応させることを含んでなる、請求項1に記載の化合物の製造方法。

【請求項3】

式IXの化合物が、式VIII：

【化3】



(VIII)

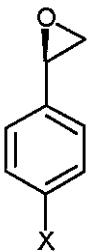
(式中、 X は、Cl、Br、又はIである)

の化合物を、金属、金属シアン化物、及び触媒と反応させることを含む方法によって製造される、請求項2に記載の方法。

【請求項4】

式VIIIの化合物が、式VII：

【化4】



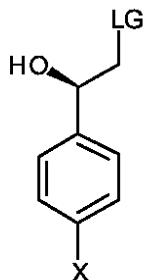
(VII)

の化合物を、第一の塩基及びトリC₁₋₆アルキルホスホノアセタートの混合物と反応させ、次いで得られた混合物を第二の塩基と反応させることを含む方法によって製造される、請求項3に記載の方法。

【請求項5】

式VIIの化合物が、式VI：

【化5】



(VI)

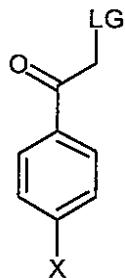
(式中、LGは、Cl、Br、I、トシラート、プロシラート、ノシラート、メシラート、又はトリフラートである)

の化合物を、塩基と反応させることを含む方法によって製造される、請求項4に記載の方法。

【請求項6】

式VIの化合物が、式V：

【化6】



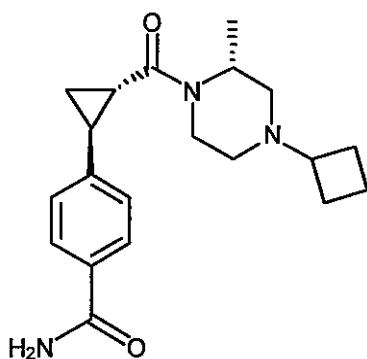
(V)

の化合物を、還元剤及びキラルなオキサザボロリジンと反応させることを含む方法によって製造される、請求項5に記載の方法。

【請求項7】

式Ib：

【化7】

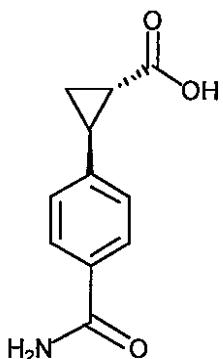


(Ib)

の化合物、又はその製薬学的に許容される塩を製造する方法であって：

その方法が、式 I a：

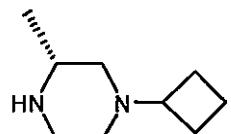
【化8】



(Ia)

の化合物を、(1)活性化剤、及び(2)式IVa：

【化9】



(IVa)

の化合物、又はその適切な塩と反応させることを含んでなる、上記方法。

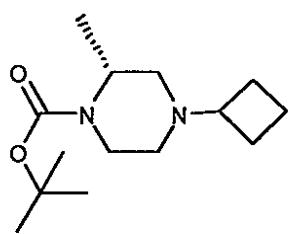
【請求項8】

前記活性化剤が、1,1'-カルボニルジイミダゾールである、請求項7に記載の方法。

【請求項9】

式IVaの化合物、又はその適切な塩が、式IIIa：

【化10】



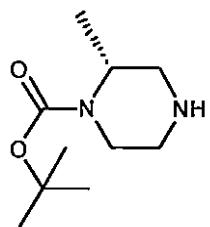
(III a)

の化合物を酸と反応させることを含む方法によって製造される、請求項7に記載の方法。

【請求項10】

式IIIAの化合物が、式IIIA：

【化11】



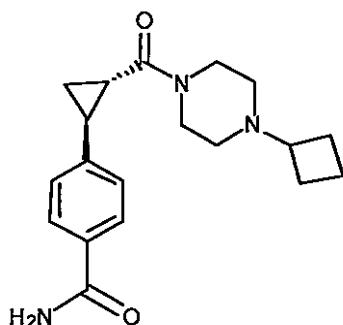
(II a)

の化合物を、シクロブタノン及び還元剤と反応させることを含む方法によって製造される、請求項9に記載の方法。

【請求項11】

式Ic：

【化12】

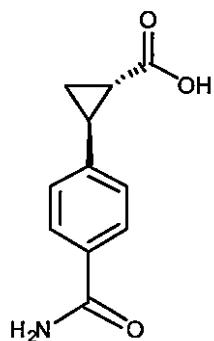


(I c)

の化合物、又はその製薬学的に許容される塩を製造する方法であつて：

その方法が、式Ia：

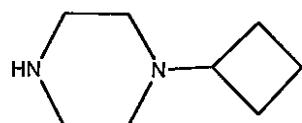
【化13】



(Ia)

の化合物を、(1)活性化剤及び式IVb:

【化14】



(IVb)

の化合物、又はその適切な塩、及び(2)塩基と反応させることを含んでなる、上記方法。

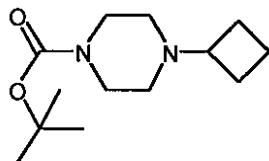
【請求項12】

活性化剤が、1-ヒドロキシベンゾトリアゾールと1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩の混合物である、請求項11に記載の方法。

【請求項13】

式IVbの化合物が、式IIIb:

【化15】



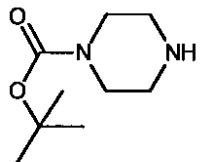
(IIIb)

の化合物を酸と反応させることを含む方法によって製造される、請求項11に記載の方法。

【請求項14】

式IIIbの化合物が、式IIb:

【化16】



(IIb)

の化合物を、シクロブタノン及び還元剤と反応させることを含む方法によって製造される

、請求項 1 3 に記載の方法。

【請求項 1 5】

前記還元剤がトリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウムである、請求項 1 0 又は 1 4 に記載の方法。