

【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16年11月25日(2004.11.25)

【公表番号】特表2000-507574(P2000-507574A)

【公表日】平成12年6月20日(2000.6.20)

【出願番号】特願平9-535252

【国際特許分類第7版】

C 07H 17/08

【F I】

C 07H 17/08

B

【手続補正書】

【提出日】平成16年2月5日(2004.2.5)

【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】

手 続 補 正 書

平成16年2月5日 適

特許庁長官 殿

1. 事件の表示 平成9年特許願第535252号

2. 補正をする者

名 称 アボット・ラボラトリーズ

3. 代 理 人 東京都新宿区新宿1丁目1番11号 友泉新宿御苑ビル

(郵便番号 160-0022) 電話 (03)3354-8623

(6200) 弁理士 川 口 義 雄

4. 補正命令の日付 自 発

5. 補正により増加する請求項の数 なし

6. 補正対象書類名 請求の範囲

7. 補正対象項目名 請求の範囲

8. 補正の内容

(1) 請求の範囲を別紙の通り補正する。

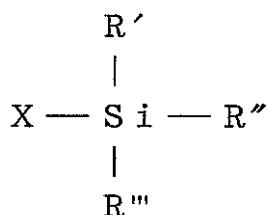


[別 紙]

請求の範囲

1. 9-オキシムエリトロマイシンA誘導体をシリル化して9-オキシムシリルエリトロマイシンA誘導体を形成し、次いで9-オキシムシリルエリトロマイシンA誘導体をアルキル化剤と反応させることを含む、6-O-アルキルエリトロマイシンA誘導体の製造方法。

2. 9-オキシムエリトロマイシンA誘導体と、式：



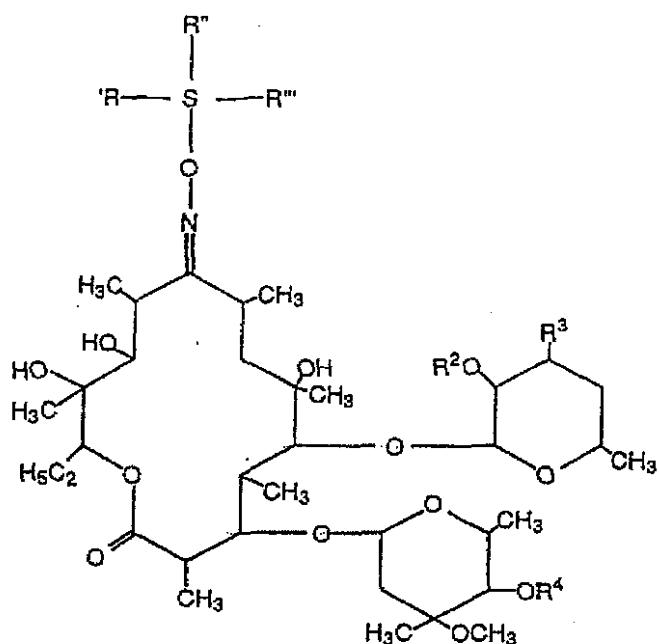
(式中、R'、R''及びR'''は独立して、水素、低級アルキル、アリール、フェニル、フェニル置換低級アルキル、シクロアルキルまたはアルケニルであり、Xはハロゲンまたはスルホネートである)のシリル化剤とを反応させることによりシリル化を実施する、請求項1に記載の方法。

3. 9-オキシムエリトロマイシンA誘導体が、(a)2'-ヒドロキシル基の水素、(b)4'-ヒドロキシル基の水素、(c)3'-ジメチルアミノ基のメチル基、(d)2'-ヒドロキシル基及び4'-ヒドロキシル基の水素、(e)3'-ジメチルアミノ基のメチル基及び2'-または4'-ヒドロキシル基の水素の一方、または(f)3'-ジメチルアミノ基のメチル基並びに2'-及び4'-ヒドロキシル基の両方の水素の代わりに、慣用の保護基を有する請求項1に記載の方法。

4. 9-オキシムエリトロマイシンA誘導体が、(a)2'-ヒドロキシル基の水素の代わりに慣用のO-保護基、(b)4'-ヒドロキシル基の水素の代わりに慣用のO-保護基、(c)2'-ヒドロキシル基及び4'-ヒドロキシル基の両方の水素の代わりに慣用のO-保護基、(d)2-アルケニル基、ベンジル基または置換ベンジル基との第4級塩として保護された3'-ジメチルアミノ基、(e)2-アルケニル基、ベンジル基または置換ベンジル基との第4級塩として保護された3'-ジメチルアミノ基及び2'-または4'-ヒドロキシル基の一方の水素の代わりに慣用の

O-保護基、または、(f)2-アルケニル基、ベンジル基または置換ベンジル基との第4級塩として保護された3'ージメチルアミノ基並びに2'ー及び4"ーヒドロキシル基の両方の水素の代わりに慣用のO-保護基を有する請求項1に記載の方法。

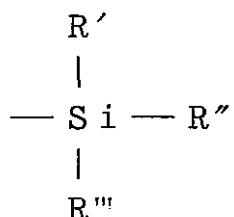
5. 9-オキシムシリルエリトロマイシンA誘導体が、以下の構造I：



I

[式中、R'、R''及びR'''は各々独立して、水素、低級アルキル、アリール、フェニル、フェニル置換低級アルキル、シクロアルキルまたはアルケニルであり；R²及びR⁴は、各々独立して、水素、シリル、アルキルカルボニル、アルコキカルボニル、アシル、低級アルケニルモノカルボニル、低級アルコキシカルボニルアルキルカルボニルまたはアリールカルボニルであり；及びR³は、-NR⁵(CH₃)₂（但し、R⁵はメチル(CH₃)または慣用のN-保護基である）であるか、-N⁺(CH₃)₂R⁶X⁻（但し、R⁶は2-アルケニル、ベンジル若しくは置換ベンジルであり、Xはハロゲン、例えば、Br、ClまたはIである）であるが、但し、R²及びR⁴の少なくとも一方は水素ではない】を有する請求項1に記載の方法。

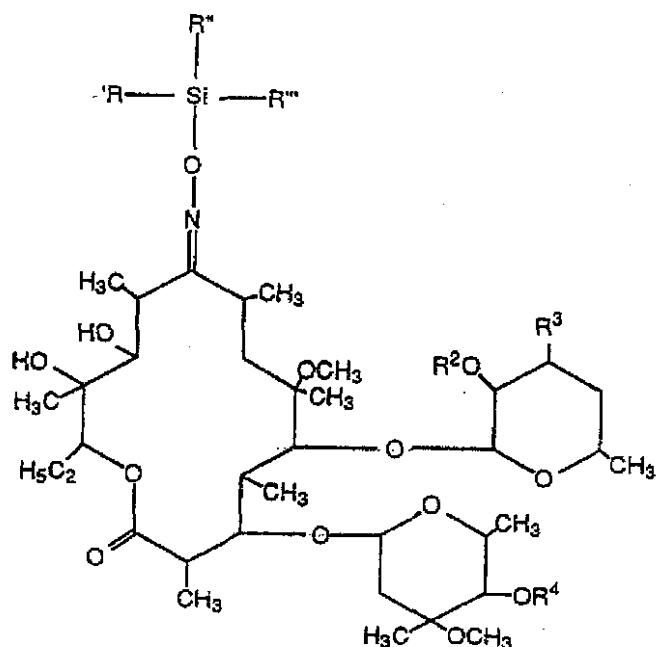
6. R³が-N(CH₃)₂であり、R²及びR⁴が両方とも式：



である請求項3に記載の方法。

7. 請求項1に記載の方法により製造した6-O-アルキル、9-Oキシムシリル、エリトロマイシンA誘導体。

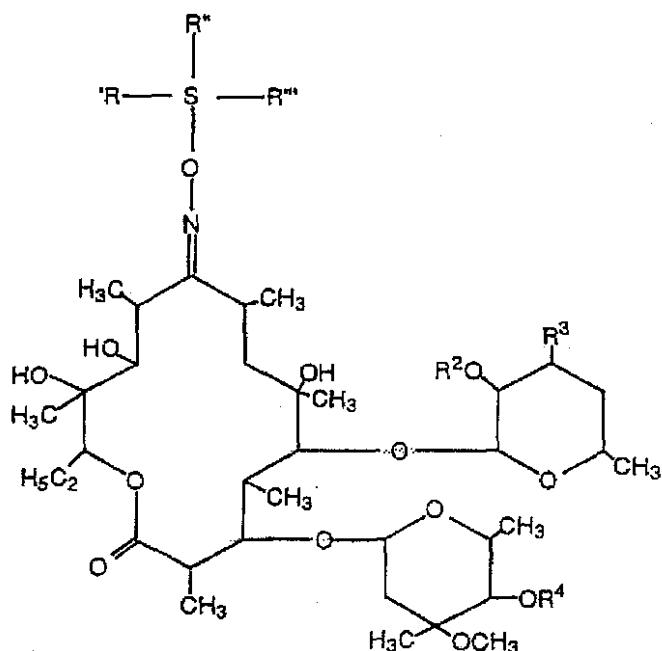
8. 構造II:



II

[式中、R'、R''及びR'''は各々独立して、水素、低級アルキル、アリール、フェニル、フェニル置換低級アルキル、シクロアルキルまたはアルケニルであり；R²及びR⁴は、各々独立して、水素、シリル、アルコキシカルボニル、アルキルカルボニル、アシル、低級アルケニルモノカルボニル、低級アルコキシカルボニルアルキルカルボニルまたはアリールカルボニルであり；及びR³は、-NR⁵(CH₃)₂（但し、R⁵はメチル(CH₃)または慣用のN-保護基である）であるか、-N^{+(CH₃)₂R⁶X⁻（但し、R⁶は2-アルケニル、ベンジル若しくは置換ベンジルであり、Xはハロゲン、例えば、Br、ClまたはIである）である]を有する化合物。}

9. 以下の構造 I :



I

[式中、R'、R'' 及び R'''は各々独立して、水素、低級アルキル、アリール、フェニル、フェニル置換低級アルキル、シクロアルキルまたはアルケニルであり；R²及び R⁴は、各々独立して、水素、シリル、アルコキシカルボニル、アルキルカルボニル、アシル、低級アルケニルモノカルボニル、低級アルコキシカルボニルアルキルカルボニルまたはアリールカルボニルであり；及び R³は、-NR⁵(CH₃)₂（但し、R⁵はメチル(CH₃)または慣用のN-保護基である）であるか、-N^{+(CH₃)₂R⁶X⁻（但し、R⁶は2-アルケニル、ベンジル若しくは置換ベンジルであり、Xはハロゲン、例えば、Br、ClまたはIである）である]を有する化合物。}

10. 請求項1に記載の方法により製造したエリトロマイシンA 9-オキシムシリル、6-O-アルキル誘導体を脱オキシム化することを含む 6-O-アルキルエリトロマイシンA の製造法。