

【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20年3月6日(2008.3.6)

【公表番号】特表2007-522206(P2007-522206A)

【公表日】平成19年8月9日(2007.8.9)

【年通号数】公開・登録公報2007-030

【出願番号】特願2006-553050(P2006-553050)

【国際特許分類】

C 0 7 D 405/04 (2006.01)

C 0 7 D 257/04 (2006.01)

C 0 7 C 235/46 (2006.01)

C 0 7 B 61/00 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 405/04 C S P

C 0 7 D 257/04 B

C 0 7 C 235/46

C 0 7 B 61/00 3 0 0

【手続補正書】

【提出日】平成20年1月17日(2008.1.17)

【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

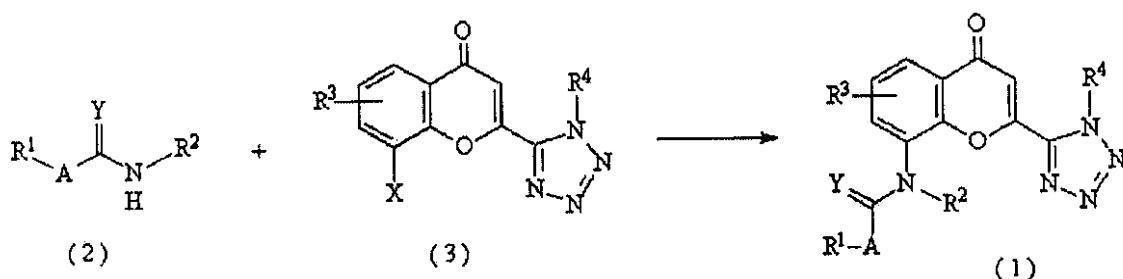
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

下記化学式 2 で表される化合物と下記化学式 3 で表される化合物を反応させることを特徴とする下記化学式 1 で表される化合物、その塩またはその溶媒和物の製造方法。

【化 1】



前記式において、

R¹はC₁₋₂₀アルキル基、C₂₋₂₀アルケニル基、C₂₋₂₀アルキニル基、フェニル基、ナフタレニル基およびインダニル基からなる群から選択され、これらは各々C₁₋₂₀アルキル基、C₂₋₂₀アルケニル基およびC₂₋₂₀アルキニル基からなる群から選択された1個乃至2個の置換基（これら置換基を構成する炭素原子のうち最大5個までは選択的に酸素原子、硫黄原子、窒素原子、ハロゲン原子、ベンゼン環、チオフェン環、ナフタレン環、C₄₋₇炭素環、カルボニル基、カルボニルオキシ基、ヒドロキシ基、カルボキシ基、アジド基またはニトロ基によって置換される）で置換されていてもよく、

R²およびR⁴は各々水素原子、C₁₋₆アルキル基、C₂₋₆アルケニル基、1～3個のアリール基で置換されたC₁₋₆アルキル基、C₁₋₆アルコキシカルボニル基、アリール基で置換されたC₁₋₆アルコキシカルボニル基、アリールオキシカルボニル基、C₁₋₆アルコキシC

$1-6$ アルキル基、 C_{3-9} トリアルキルスズ基、トリアリールスズ基、または C_{3-9} トリアルキルシリル基を表し、この時、アリール基またはアリールはフェニル基、またはハロゲン原子、 C_{1-6} アルキル基および C_{1-6} アルコキシ基からなる群から選択された 1 ~ 3 個の置換基で置換されたフェニル基であり、

R^3 は水素原子、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ニトロ基、 C_{1-6} アルキル基、 C_{1-6} アルコキシ基、 C_{1-6} アルキルチオ基、または $-COOR^5$ (この時、 R^5 は水素原子または C_{1-6} アルキル基) を表し、

A は単結合であるか、または C_{1-10} アルキル基およびフェニル基のうちから選択された 1 乃至 3 個の置換基で置換または非置換された C_{1-10} アルキレン基、 C_{2-10} アルケニレン基、または C_{2-10} アルキニレン基であり、

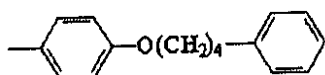
X はハロゲン原子であり、

Y は酸素原子または硫黄原子である。

【請求項 2】

前記 R^1 が

【化 2】



であり、 R^2 、 R^3 および R^4 が各々水素原子であり、A が単結合であり、X が I、Br または Cl であり、Y が酸素原子であることを特徴とする請求項 1 記載の製造方法。

【請求項 3】

前記反応が、パラジウムまたは銅含有化合物の触媒、ジアミンリガンドおよび塩基の存在下で行われることを特徴とする請求項 1 記載の製造方法。

【請求項 4】

前記反応がヨード化銅、塩化銅および Cu_2O からなる群から選択された触媒、N, N'-ジメチルエチレンジアミン、トランス-N, N'-1, 2-シクロヘキサレンジアミンおよびトランス-N, N'-ジメチル-1, 2-シクロヘキサレンジアミンからなる群から選択されたりガンド、炭酸セシウムおよびリン酸カリウムからなる群から選択された塩基の存在下で行われることを特徴とする請求項 3 記載の製造方法。

【請求項 5】

前記反応がヨード化銅の触媒、N, N'-ジメチルエチレンジアミンリガンドおよびリン酸カリウム塩基の存在下で行われることを特徴とする請求項 4 記載の製造方法。

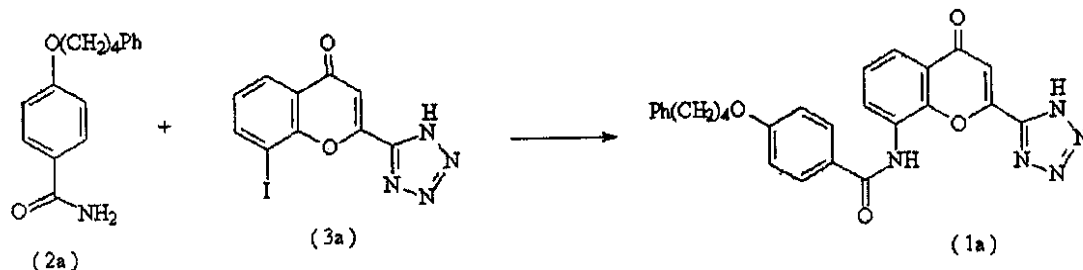
【請求項 6】

前記反応がジメチルホルムアミド溶媒を使用する条件で行われることを特徴とする請求項 3 乃至 5 のいずれか 1 項記載の製造方法。

【請求項 7】

下記化学式 2 a で表される化合物と下記化学式 3 a で表される化合物、その塩またはその溶媒和物を反応させ、下記化学式 1 a で表される化合物、その塩またはその溶媒和物を製造することを特徴とする請求項 1 記載の製造方法。

【化 3】



【請求項 8】

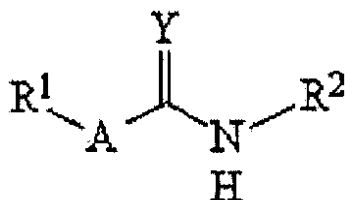
前記反応がジメチルホルムアミド溶媒、ヨード化銅の触媒、N, N'-ジメチルエチレ

ンジアミンリガンドおよびリン酸カリウム塩基の存在下で 70 ~ 100 で行われることを特徴とする請求項 7 記載の製造方法。

【請求項 9】

下記化学式 2 で表される中間体化合物、その塩またはその溶媒和物。

【化 4】



前記化学式 2 において、 R^1 、 R^2 、A および Y は各々請求項 1 で定義したものと同一である。

【請求項 10】

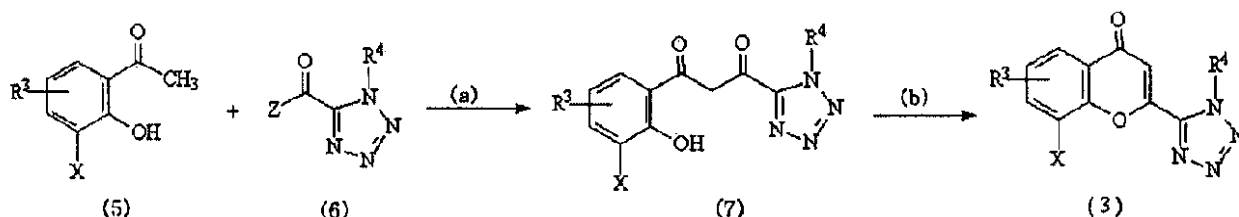
前記化学式 2 で表される中間体化合物が 4 - (4 - フェニルブトキシ) ベンズアミドであることを特徴とする請求項 9 記載の化合物。

【請求項 11】

(a) 下記化学式 5 で表される化合物と下記化学式 6 で表される化合物を反応させ、下記化学式 7 で表される化合物を製造した後、

(b) 工程 (a) で得られた化合物を環化反応させることを特徴とする下記化学式 3 で表される化合物の製造方法。

【化 5】



前記化学式において、 R^3 、 R^4 および X は各々請求項 1 で定義したものと同一であり、Z は活性化された離脱基を表す。

【請求項 12】

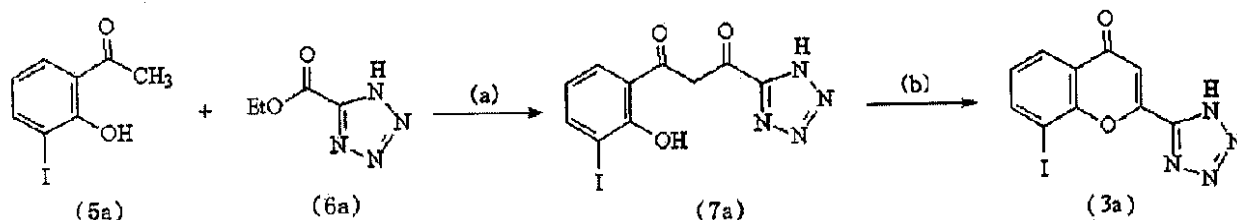
前記環化反応が硫酸存在下でメタノール溶媒を使用して行われることを特徴とする請求項 11 記載の製造方法。

【請求項 13】

(a) 下記化学式 5 a で表される化合物と下記化学式 6 a で表される化合物、その塩またはその溶媒和物を反応させ、下記化学式 7 a で表される化合物、その塩またはその溶媒和物を製造した後、

(b) 工程 (a) で得られた化合物を環化反応させ、下記化学式 3 a で表される化合物、その塩またはその溶媒和物を製造することを特徴とする請求項 11 記載の製造方法。

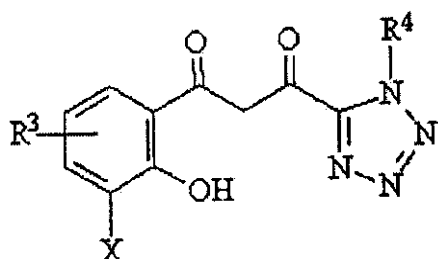
【化 6】



【請求項 1 4】

下記化学式 7 で表されることを特徴とする中間体化合物、その塩またはその溶媒和物。

【化 7】



前記化学式 7 において、 R^3 、 R^4 および X は各々請求項 1 で定義したものと同一である。

【請求項 1 5】

2 - ヨード - 6 - [1 , 3 - ジオキソ - 3 - (テトラゾール - 5 - イル) プロピル] フェノールである請求項 1 4 記載の化合物。