

【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 07 D 405/04 (2006.01)

C 07 D 257/04 (2006.01)

C 07 C 235/46 (2006.01)

C 07 B 61/00 (2006.01)

【F I】

C 07 D 405/04 C S P

C 07 D 257/04 B

C 07 C 235/46

C 07 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

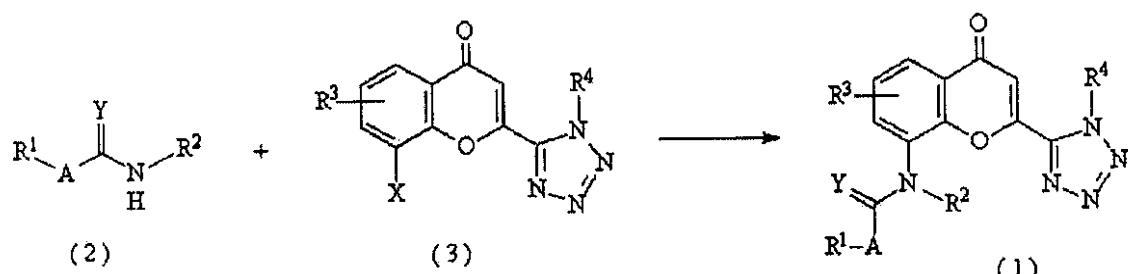
【補正の内容】

【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、

R^1 は C_{1-20} アルキル基、 C_{2-20} アルケニル基、 C_{2-20} アルキニル基、フェニル基、ナフタレン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 C_{1-20} アルキル基、 C_{2-20} アルケニル基および C_{2-20} 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、 C_{4-7} 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、

R^2 および R^4 は各々水素原子、 C_{1-6} アルキル基、 C_{2-6} アルケニル基、1~3個のアリール基で置換された C_{1-6} アルキル基、 C_{1-6} アルコキシカルボニル基、アリール基で置換された C_{1-6} アルコキシカルボニル基、アリールオキシカルボニル基、 C_{1-6} アルコキシC

₁₋₆ アルキル基、C₃₋₉トリアルキルスズ基、トリアリールスズ基、またはC₃₋₉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、C₁₋₆アルキル基およびC₁₋₆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C₁₋₁₀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C₁₋₁₀アルキレン基、C₂₋₁₀アルケニレン基、またはC₂₋₁₀アルキニレン基であり、

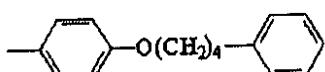
×は八日根原子であり、

Y は酸素原子または硫黄原子である。

【請求項2】

前記 R¹ が

【化 2】



であり、R²、R³およびR⁴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Cu₂O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-シクロヘキサンジアミンからなる群から選択されたリガンド、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。

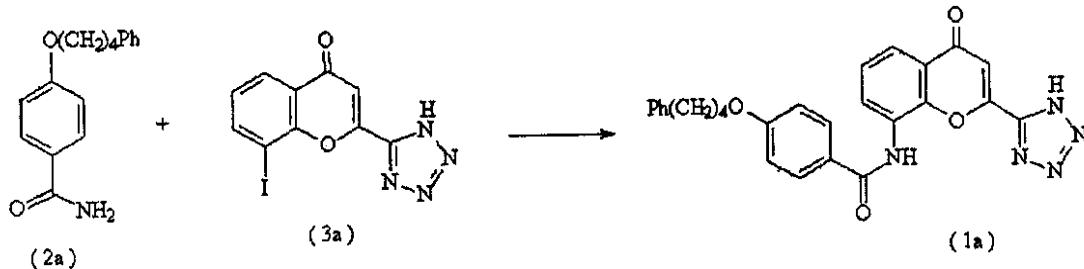
【請求項 6】

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】

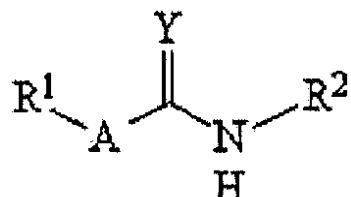
前記反応がジメチルホルムアミド溶媒、ヨード化銅の触媒、N,N'-ジメチルエチレ

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、R¹、R²、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】

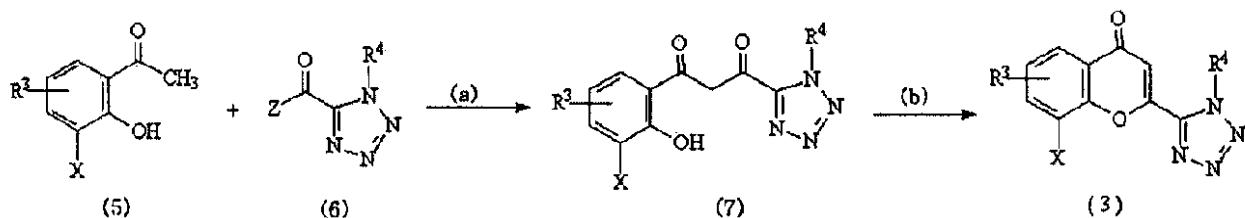
前記化学式2で表される中間体化合物が4-(4-フェニルブトキシ)ベンズアミドであることを特徴とする請求項9記載の化合物。

【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、R³、R⁴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】

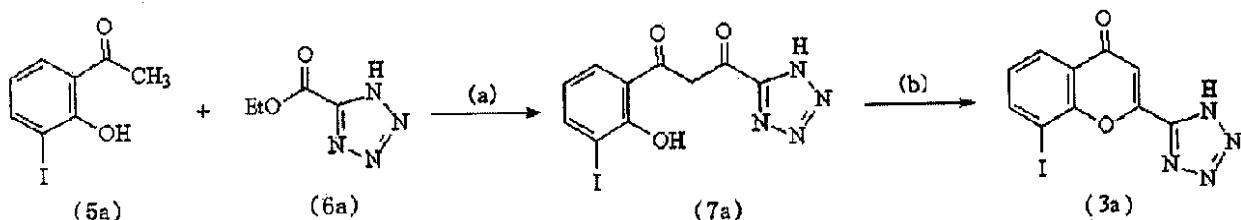
前記環化反応が硫酸存在下でメタノール溶媒を使用して行われることを特徴とする請求項11記載の製造方法。

【請求項13】

(a) 下記化学式5aで表される化合物と下記化学式6a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7a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3a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。

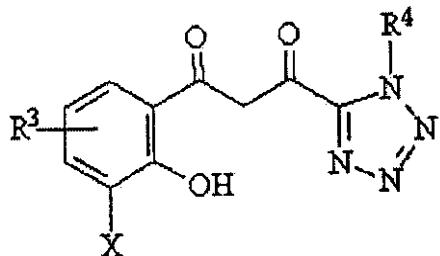
【化 6】



【請求項 14】

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で定義したものの同一である。

○

【請求項 15】

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 14 記載の化合物。