

【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 21 年 7 月 2 日 (2009.7.2)

【公表番号】特表 2008-526881 (P2008-526881A)

【公表日】平成 20 年 7 月 24 日 (2008.7.24)

【年通号数】公開・登録公報 2008-029

【出願番号】特願 2007-550519 (P2007-550519)

【国際特許分類】

C 07 D 401/12 (2006.01)

【F I】

C 07 D 401/12

【手続補正書】

【提出日】平成 21 年 5 月 18 日 (2009.5.18)

【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

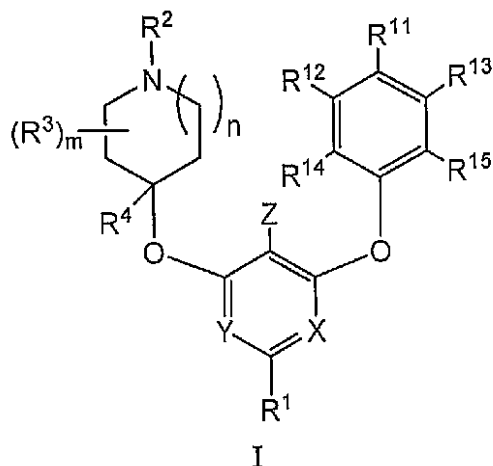
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I :

【化 1】



の化合物を調製する方法であって、

X は、N または C R⁷ であり；

Y は、N または C R⁸ であり；

Z は、C₁ ~ 5 アシル、C₁ ~ 5 アシルオキシ、C₂ ~ 6 アルケニル、C₁ ~ 4 アルコキシ、C₁ ~ 8 アルキル、C₁ ~ 4 アルキルカルボキサミド、C₂ ~ 6 アルキニル、C₁ ~ 4 アルキルチオカルボキサミド、C₁ ~ 4 アルキルスルホンアミド、C₁ ~ 4 アルキルスルフィニル、C₁ ~ 4 アルキルスルホニル、C₁ ~ 4 アルキルチオ、C₁ ~ 4 アルキルチオウレイル、C₁ ~ 4 アルキルウレイル、アミノ、C₁ ~ 2 アルキルアミノ、C₂ ~ 4 ジアルキルアミノ、カルバムイミドイル、カルボ - C₁ ~ 6 - アルコキシ、カルボキサミド、カルボキシ、シアノ、C₃ ~ 7 シクロアルキル、C₄ ~ 8 ジアシルアミノ、C₂ ~ 6 ジアルキルカルボキサミド、C₂ ~ 6 ジアルキルチオカルボキサミド、C₂ ~ 6 ジアルキルスルホンアミド、C₂ ~ 6 ジアルキルスルホニルアミノ、ホルミル、C₁ ~ 4 ハロアル

コキシ、 $C_1 \sim 4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim 4$ ハロアルキルカルボキサミド、 $C_1 \sim 4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim 4$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim 4$ ハロアルキルチオ、ハロゲン、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクロアルキル、ヒドロキシル、ヒドロキシカルバムイミドイル、ヒドロキシルアミノ、ニトロ、またはテトラゾリルであり；該 $C_1 \sim 8$ アルキル、 $C_3 \sim 7$ シクロアルキル、およびヘテロシクロアルキルは、それぞれ必要に応じて、1個、2個、3個または4個の基で置換されており、該基は、 $C_1 \sim 5$ アシル、 $C_1 \sim 5$ アシルオキシ、 $C_1 \sim 4$ アルコキシ、 $C_1 \sim 7$ アルキル、 $C_1 \sim 4$ アルキルカルボキサミド、 $C_1 \sim 4$ アルキルスルホンアミド、 $C_1 \sim 4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim 4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim 4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim 4$ アルキルウレイル、アミノ、 $C_1 \sim 2$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim 4$ ジアルキルアミノ、カルボ - $C_1 \sim 6$ - アルコキシ、カルボキサミド、カルボキシ、シアノ、ホルミル、 $C_1 \sim 4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim 4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim 4$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim 4$ ハロアルキルチオ、ハロゲン、ヒドロキシル、ヒドロキシルアミノ、およびニトロから選択され；

R^1 は、H、 $C_1 \sim 5$ アシルオキシ、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_1 \sim 4$ アルコキシ、 $C_1 \sim 8$ アルキル、 $C_1 \sim 4$ アルキルカルボキサミド、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_1 \sim 4$ アルキルスルホンアミド、 $C_1 \sim 4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim 4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim 4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim 4$ アルキルウレイル、アミノ、 $C_1 \sim 4$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim 8$ ジアルキルアミノ、カルボキサミド、シアノ、 $C_3 \sim 7$ シクロアルキル、 $C_2 \sim 6$ ジアルキルカルボキサミド、 $C_2 \sim 6$ ジアルキルスルホンアミド、ハロゲン、 $C_1 \sim 4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim 4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim 4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim 4$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim 4$ ハロアルキルチオ、またはヒドロキシルであり；

R^2 は、 $-R^{22}$ 、 $-CR^{23}R^{24}C(O)-R^{22}$ 、 $-C(O)CR^{23}R^{24}-R^{22}$ 、 $-C(O)-R^{22}$ 、 $-CR^{23}R^{24}C(O)NR^{25}-R^{22}$ 、 $-NR^{25}C(O)CR^{23}R^{24}-R^{22}$ 、 $-C(O)NR^{23}-R^{22}$ 、 $-NR^{23}C(O)-R^{22}$ 、 $-C(O)O-R^{22}$ 、 $-OC(O)-R^{22}$ 、 $-C(S)-R^{22}$ 、 $-C(S)NR^{23}-R^{22}$ 、 $-NR^{23}C(S)-R^{22}$ 、 $-C(S)O-R^{22}$ 、 $-OC(S)-R^{22}$ 、 $-CR^{23}R^{24}-R^{22}$ 、または $-S(O)_2-R^{22}$ であり；

R^3 は、 $C_1 \sim 3$ アルキル、 $C_1 \sim 4$ アルコキシ、カルボキシ、シアノ、 $C_1 \sim 3$ ハロアルキル、またはハロゲンであり；

R^4 は、H、 $C_1 \sim 8$ アルキルまたは $C_3 \sim 7$ シクロアルキルであり、該 $C_1 \sim 8$ アルキルは、必要に応じて、 $C_1 \sim 4$ アルコキシ、 $C_3 \sim 7$ シクロアルキル、またはヘテロアリールで置換されており；

R^7 および R^8 は、それぞれ別個に、H、 $C_1 \sim 5$ アシルオキシ、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_1 \sim 4$ アルコキシ、 $C_1 \sim 8$ アルキル、 $C_1 \sim 4$ アルキルカルボキサミド、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_1 \sim 4$ アルキルスルホンアミド、 $C_1 \sim 4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim 4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim 4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim 4$ アルキルウレイル、アミノ、 $C_1 \sim 4$ アルキルアミノ、 $C_2 \sim 8$ ジアルキルアミノ、カルボキサミド、シアノ、 $C_3 \sim 7$ シクロアルキル、 $C_2 \sim 6$ ジアルキルカルボキサミド、 $C_2 \sim 6$ ジアルキルスルホンアミド、ハロゲン、 $C_1 \sim 4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim 4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim 4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim 4$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim 4$ ハロアルキルチオ、またはヒドロキシルであり；

R^{11} は、 $C_1 \sim 5$ アシル、 $C_1 \sim 6$ アシルスルホンアミド、 $C_1 \sim 5$ アシルオキシ、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_1 \sim 4$ アルコキシ、 $C_1 \sim 8$ アルキル、 $C_1 \sim 4$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim 6$ アルキルカルボキサミド、 $C_1 \sim 4$ アルキルチオカルボキサミド、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_1 \sim 4$ アルキルスルホンアミド、 $C_1 \sim 4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim 4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim 4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim 4$ アルキルチオウレイル、 $C_1 \sim 4$ アルキルウレイル、アミノ、アリールスルホニル、カルバムイミドイル、カルボ - $C_1 \sim 6$ - アルコキシ、カルボキサミド、カルボキシ、シアノ、 $C_3 \sim 7$ シクロアルキル、 $C_3 \sim 7$ シクロアルキルオキシ、 $C_2 \sim 6$ ジアルキルアミノ、 $C_2 \sim 6$ ジアルキルカルボキサミド、 $C_2 \sim 6$ ジアルキルチオカルボキサミド、グアニジニル、ハロゲン、 $C_1 \sim 4$ ハロ

アルコキシ、 $C_1 \sim 4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim 4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim 4$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim 4$ ハロアルキルチオ、ヘテロシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル - オキシ、ヘテロシクロアルキルスルホニル、ヘテロシクロアルキル - カルボニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールカルボニル、ヒドロキシル、ニトロ、 $C_4 \sim 7$ オキソ - シクロアルキル、フェノキシ、フェニル、スルホンアミド、スルホン酸、またはチオールであり；該 $C_1 \sim 5$ アシル、 $C_1 \sim 6$ アシルスルホンアミド、 $C_1 \sim 4$ アルコキシ、 $C_1 \sim 8$ アルキル、 $C_1 \sim 4$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim 6$ アルキルスルホンアミド、 $C_1 \sim 4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim 4$ アルキルチオ、アリールスルホニル、カルバマイミドイル、 $C_2 \sim 6$ ジアルキルアミノ、ヘテロシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル - カルボニル、ヘテロアリール、フェノキシおよびフェニルは、それぞれ必要に応じて、1個～5個の置換基で置換されており、該置換基は、別個に、 $C_1 \sim 5$ アシル、 $C_1 \sim 5$ アシルオキシ、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_1 \sim 4$ アルコキシ、 $C_1 \sim 7$ アルキル、 $C_1 \sim 4$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim 4$ アルキルカルボキサミド、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_1 \sim 4$ アルキルスルホンアミド、 $C_1 \sim 4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim 4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim 4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim 4$ アルキルウレイル、カルボ - $C_1 \sim 6$ - アルコキシ、カルボキサミド、カルボキシ、シアノ、 $C_3 \sim 7$ シクロアルキル、 $C_3 \sim 7$ シクロアルキルオキシ、 $C_2 \sim 6$ ジアルキルアミノ、 $C_2 \sim 6$ ジアルキルカルボキサミド、ハロゲン、 $C_1 \sim 4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim 4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim 4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim 4$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim 4$ ハロアルキルチオ、ヘテロアリール、複素環、ヒドロキシル、ニトロ、フェニル、およびホスホノオキシから選択され、該 $C_1 \sim 7$ アルキルおよび $C_1 \sim 4$ アルキルカルボキサミドは、それぞれ必要に応じて、1個～5個の置換基で置換されており、該置換基は、 $C_1 \sim 4$ アルコキシおよびヒドロキシから選択され；

R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} および R^{15} は、それぞれ別個に、H、 $C_1 \sim 5$ アシル、 $C_1 \sim 5$ アシルオキシ、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_1 \sim 4$ アルコキシ、 $C_1 \sim 8$ アルキル、 $C_1 \sim 4$ アルキルカルボキサミド、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_1 \sim 4$ アルキルスルホンアミド、 $C_1 \sim 4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim 4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim 4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim 4$ アルキルウレイル、カルボ - $C_1 \sim 6$ - アルコキシ、カルボキサミド、カルボキシ、シアノ、 $C_3 \sim 7$ シクロアルキル、 $C_2 \sim 6$ ジアルキルカルボキサミド、ハロゲン、 $C_1 \sim 4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim 4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim 4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim 4$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim 4$ ハロアルキルチオ、ヒドロキシ、またはニトロであり；

R^{22} は、H、 $C_1 \sim 8$ アルキル、 $C_3 \sim 7$ シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリール、または複素環であり、該複素環は、それぞれ必要に応じて、1個～5個の置換基で置換されており、該置換基は、 $C_1 \sim 5$ アシル、 $C_1 \sim 5$ アシルオキシ、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_1 \sim 4$ アルコキシ、 $C_1 \sim 7$ アルキル、 $C_1 \sim 4$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim 4$ アルキルカルボキサミド、 $C_1 \sim 4$ アルキルチオカルボキサミド、 $C_1 \sim 4$ アルキルスルホンアミド、 $C_1 \sim 4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim 4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim 4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim 4$ アルキルチオウレイル、 $C_1 \sim 4$ アルキルウレイル、アミノ、カルボ - $C_1 \sim 6$ - アルコキシ、カルボキサミド、カルボキシ、シアノ、 $C_3 \sim 7$ シクロアルキル、 $C_2 \sim 8$ ジアルキルアミノ、 $C_2 \sim 6$ ジアルキルカルボキサミド、 $C_2 \sim 6$ ジアルキルチオカルボキサミド、 $C_2 \sim 6$ ジアルキルスルホンアミド、 $C_1 \sim 4$ アルキルチオウレイル、 $C_1 \sim 4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim 4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim 4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim 4$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim 4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim 4$ ハロアルキルチオ、ハロゲン、ヘテロアリール、複素環、ヒドロキシル、ヒドロキシルアミノ、ニトロ、フェニル、フェノキシ、およびスルホン酸からなる群から選択され、該 $C_1 \sim 7$ アルキル、ヘテロアリール、フェニルおよびフェノキシは、それぞれ必要に応じて、1個～5個の置換基で置換されており、該置換基は、 $C_1 \sim 5$ アシル、 $C_1 \sim 5$ アシルオキシ、 $C_1 \sim 4$ アルコキシ、 $C_1 \sim 8$ アルキル、 $C_1 \sim 4$ アルキルアミノ、 $C_1 \sim 4$ アルキルカルボキサミド、 $C_1 \sim 4$ アルキルチオカルボキサミド、 $C_1 \sim 4$ アルキルスルホンアミド、 $C_1 \sim 4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim 4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim 4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim$

C_4 アルキルチオウレイル、 $C_1 \sim 4$ アルキルウレイル、アミノ、カルボ - $C_1 \sim 6$ - アルコキシ、カルボキサミド、カルボキシ、シアノ、 $C_3 \sim 7$ シクロアルキル、 $C_2 \sim 8$ ジアルキルアミノ、 $C_2 \sim 6$ ジアルキルカルボキサミド、 $C_2 \sim 6$ ジアルキルチオカルボキサミド、 $C_2 \sim 6$ ジアルキルスルホンアミド、 $C_1 \sim 4$ アルキルチオウレイル、 $C_1 \sim 4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim 4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim 4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim 4$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim 4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim 4$ ハロアルキルチオ、ハロゲン、複素環、ヒドロキシル、ヒドロキシルアミノ、およびニトロからなる群から選択され；

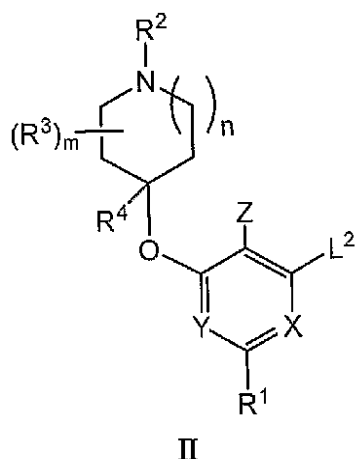
R^{23} 、 R^{24} および R^{25} は、それぞれ別個に、H または $C_1 \sim 8$ アルキルであり；

n は、0 または 1 であり；そして

m は、0、1、2、3 または 4 であり；

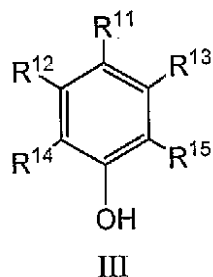
該方法は、ヨウ化物塩 および塩基の存在下にて、式 I I：

【化 2】



の化合物と式 I I I：

【化 3】



の化合物とを反応させて、それにより、式 I の化合物を形成する工程を包含し、

L^2 は、脱離基である、

方法。

【請求項 2】

前記塩が、テトラ ($C_1 \sim 8$ アルキル) アンモニウム ヨウ化物塩 である、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 3】

前記塩が、テトラブチルヨウ化アンモニウム である、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 4】

前記塩基が、アルカリ金属アミド、水素化アルカリ金属、炭酸アルカリ金属、または炭酸水素アルカリ金属である、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 5】

前記塩基が、 K_2CO_3 である、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 6】

前記反応が、高温で実行される、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 7】

前記反応が、約 120 ~ 約 140 の温度で実行される、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 8】

前記反応が、溶媒中で実行される、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 9】

前記溶媒が、DMSOを含む、請求項 8 に記載の方法。

【請求項 10】

L² が、ハロである、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 11】

L² が、Cl である、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 12】

X および Y の両方が、N である、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 13】

Z が、C₁ ~ 5 アシル、C₁ ~ 5 アシルオキシ、C₂ ~ 6 アルケニル、C₁ ~ 4 アルコキシ、C₁ ~ 8 アルキル、C₂ ~ 6 アルキニル、ホルミル、C₁ ~ 4 ハロアルコキシ、C₁ ~ 4 ハロアルキル、ハロゲン、ヒドロキシル、またはニトロである、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 14】

Z が、メチルである、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 15】

R¹ が、H である、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 16】

R² が、-C(O)O-R²² であり、R²² が、メチル、エチル、プロパ-1-イル、またはプロパ-2-イルである、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 17】

R² が、-C(O)O-R²² であり、R²² が、プロパ-2-イルである、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 18】

R⁴ が、H である、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 19】

n が、1 である、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 20】

m が、0 である、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 21】

R¹¹ が、C₁ ~ 4 アルキルスルホニルである、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 22】

R¹¹ が、メチルスルホニルである、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 23】

R¹²、R¹³、R¹⁴ および R¹⁵ が、それぞれ別個に、H またはハロゲンである、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 24】

R¹⁵ が、F である、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 25】

R¹¹ が、C₁ ~ 4 アルキルスルホニルであり；R¹²、R¹³ および R¹⁴ が、それぞれ、H であり；R¹⁵ が、ハロゲンである、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 26】

請求項 1 に記載の方法であって、

X は、N であり；

Y は、N であり；

Z は、メチルであり；
 R^1 は、H であり；
 R^2 は、 $-C(O)O-R^{22}$ であり；
 R^4 は、H であり；
 R^{11} は、メチルスルホニルであり；
 R^{12} 、 R^{13} および R^{14} は、それぞれ、H であり；
 R^{15} は、F であり；
 R^{22} は、プロパ-2-イルであり；
 n は、1 であり；そして
 m は、0 である、

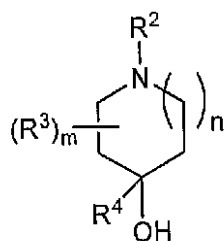
方法。

【請求項 27】

前記式 I I の化合物が、

a) 式 I V：

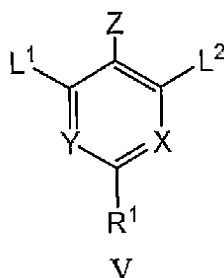
【化 4】



IV

の化合物と式 V：

【化 5】



V

の化合物とを混ぜ合わせて、混合物を形成する工程であって、 L^1 は、脱離基である、工程；

b) 該混合物に塩基を加え、それにより、式 I I の化合物を形成する工程；
 により調製される、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 28】

前記塩基が、 $C_1 \sim 6$ アルコキシド塩、アルカリ金属アミド、水素化アルカリ金属、炭酸アルカリ金属、または炭酸水素アルカリ金属である、請求項 27 に記載の方法。

【請求項 29】

前記塩基が、カリウム t-ブトキシドである、請求項 27 に記載の方法。

【請求項 30】

前記混ぜ合わせる工程および加える工程が、溶媒中で実行される、請求項 27 に記載の方法。

【請求項 31】

前記溶媒が、テトラヒドロフランを含む、請求項 30 に記載の方法。

【請求項 32】

前記加える工程が、約 10 未満の温度で、実行される、請求項 27 に記載の方法。

【請求項 33】

L¹ が、ハ口である、請求項 2 7 に記載の方法。

【請求項 3 4】

L¹ が、C 1 である、請求項 2 7 に記載の方法。