

【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

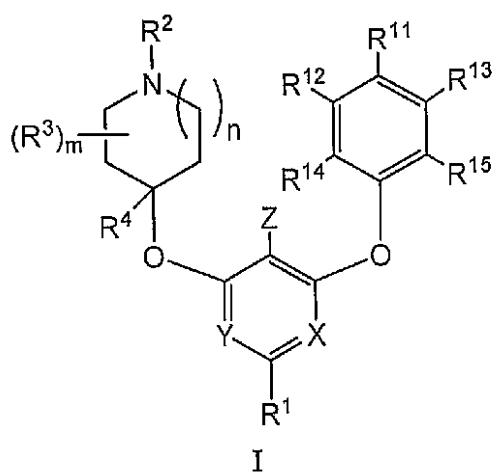
【補正の内容】

【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CR⁷であり；

Yは、NまたはCR⁸であり；

Zは、C_{1～5}アシル、C_{1～5}アシルオキシ、C_{2～6}アルケニル、C_{1～4}アルコキシ、C_{1～8}アルキル、C_{1～4}アルキルカルボキサミド、C_{2～6}アルキニル、C_{1～4}アルキルチオカルボキサミド、C_{1～4}アルキルスルホンアミド、C_{1～4}アルキルスルフィニル、C_{1～4}アルキルスルホニル、C_{1～4}アルキルチオ、C_{1～4}アルキルチオウレイル、C_{1～4}アルキルウレイル、アミノ、C_{1～2}アルキルアミノ、C_{2～4}ジアルキルアミノ、カルバムイミドイル、カルボ-C_{1～6}-アルコキシ、カルボキサミド、カルボキシ、シアノ、C_{3～7}シクロアルキル、C_{4～8}ジアシルアミノ、C_{2～6}ジアルキルカルボキサミド、C_{2～6}ジアルキルチオカルボキサミド、C_{2～6}ジアルキルスルホンアミド、C_{2～6}ジアルキルスルホニルアミノ、ホルミル、C_{1～4}ハロアル

コキシ、C₁～₄ハロアルキル、C₁～₄ハロアルキルカルボキサミド、C₁～₄ハロアルキルスルフィニル、C₁～₄ハロアルキルスルホニル、C₁～₄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、ヒドロキシリ、ヒドロキシカルバムイミドイル、ヒドロキシリアミノ、ニトロ、またはテトラゾリルであり；該C₁～₈アルキル、C₃～₇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、C₁～₅アシル、C₁～₅アシルオキシ、C₁～₄アルコキシ、C₁～₇アルキル、C₁～₄アルキルカルボキサミド、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、カルボ-C₁～₆-アルコキシ、カルボキサミド、カルボキシ、シアノ、ホルミル、C₁～₄ハロアルコキシ、C₁～₄ハロアルキルスルフィニル、C₁～₄ハロアルキルスルホニル、C₁～₄ハロアルキルチオ、ハロゲン、ヒドロキシリ、ヒドロキシリアミノ、およびニトロから選択され；

R¹は、H、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アルキルウレイル、アミノ、C₁～₄アルキルアミノ、C₂～₈ジアルキルアミノ、カルボキサミド、シアノ、C₃～₇シクロアルキル、C₂～₆ジアルキルカルボキサミド、C₂～₆ジアルキルスルホンアミド、ハロゲン、C₁～₄ハロアルコキシ、C₁～₄ハロアルキル、C₁～₄ハロアルキルスルフィニル、C₁～₄ハロアルキルスルホニル、C₁～₄ハロアルキルチオ、またはヒドロキシリであり；

R²は、-R²²、-CR²³R²⁴C(O)-R²²、-C(O)CR²³R²⁴-R²²、-C(O)-R²²、-CR²³R²⁴C(O)NR²⁵-R²²、-NR²⁵C(O)CR²³R²⁴-R²²、-C(O)NR²³-R²²、-NR²³C(O)-R²²、-C(O)O-R²²、-OC(O)-R²²、-C(S)-R²²、-C(S)NR²³-R²²、-NR²³C(S)-R²²、-C(S)O-R²²、-OC(S)-R²²、-CR²³R²⁴-R²²、または-S(O)₂-R²²であり；

R³は、C₁～₃アルキル、C₁～₄アルコキシ、カルボキシ、シアノ、C₁～₃ハロアルキル、またはハロゲンであり；

R⁴は、H、C₁～₈アルキルまたはC₃～₇シクロアルキルであり、該C₁～₈アルキルは、必要に応じて、C₁～₄アルコキシ、C₃～₇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；

R⁷およびR⁸は、それぞれ別個に、H、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アルキルウレイル、アミノ、C₁～₄アルキルアミノ、C₂～₈ジアルキルアミノ、カルボキサミド、シアノ、C₃～₇シクロアルキル、C₂～₆ジアルキルカルボキサミド、C₂～₆ジアルキルスルホンアミド、ハロゲン、C₁～₄ハロアルコキシ、C₁～₄ハロアルキル、C₁～₄ハロアルキルスルフィニル、C₁～₄ハロアルキルスルホニル、C₁～₄ハロアルキルチオ、またはヒドロキシリであり；

R¹は、C₁～₅アシル、C₁～₆アシルスルホンアミド、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アルキルアミノ、C₁～₆アルキルカルボキサミド、C₁～₄アルキルチオカルボキサミド、C₂～₆アルキニル、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、アリールスルホニル、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、C₃～₇シクロアルキルオキシ、C₂～₆ジアルキルアミノ、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、グアニジニル、ハロゲン、C₁～₄ハロ

アルコキシ、C₁～₄ハロアルキル、C₁～₄ハロアルキルスルフィニル、C₁～₄ハロアルキルスルホニル、C₁～₄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、ヒドロキシリ、ニトロ、C₄～₇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C₁～₅アシル、C₁～₆アシルスルホンアミド、C₁～₄アルコキシ、C₁～₈アルキル、C₁～₄アルキルアミノ、C₁～₆アルキルスルホンアミド、C₁～₄アルキルスルホニル、C₁～₄アルキルチオ、アリールスルホニル、カルバムイミドイル、C₂～₆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、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、C₁～₇アルキル、C₁～₄アルキルアミノ、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アルキルウレイル、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、C₃～₇シクロアルキルオキシ、C₂～₆ジアルキルアミノ、C₂～₆ジアルキルカルボキサミド、ハロゲン、C₁～₄ハロアルコキシ、C₁～₄ハロアルキル、C₁～₄ハロアルキルスルフィニル、C₁～₄ハロアルキルスルホニル、C₁～₄ハロアルキルチオ、ヘテロアリール、複素環、ヒドロキシリ、ニトロ、フェニル、およびホスホノオキシから選択され、該C₁～₇アルキルおよびC₁～₄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、C₁～₄アルコキシおよびヒドロキシから選択され；

R¹₂、R¹₃、R¹₄およびR¹₅は、それぞれ別個に、H、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アルキルウレイル、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、C₂～₆ジアルキルカルボキサミド、ハロゲン、C₁～₄ハロアルコキシ、C₁～₄ハロアルキル、C₁～₄ハロアルキルスルフィニル、C₁～₄ハロアルキルスルホニル、C₁～₄ハロアルキルチオ、ヒドロキシリ、またはニトロであり；

R²₂は、H、C₁～₈アルキル、C₃～₇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、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、C₁～₇アルキル、C₁～₄アルキルアミノ、C₁～₄アルキルカルボキサミド、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、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、C₂～₈ジアルキルアミノ、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、C₁～₄アルキルチオウレイル、C₁～₄ハロアルコキシ、C₁～₄ハロアルキル、C₁～₄ハロアルキルスルフィニル、C₁～₄ハロアルキルスルホニル、C₁～₄ハロアルキル、C₁～₄ハロアルキルチオ、ハロゲン、ヘテロアリール、複素環、ヒドロキシリ、ヒドロキシリアミノ、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C₁～₇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、C₁～₅アシル、C₁～₅アシルオキシ、C₁～₄アルコキシ、C₁～₈アルキル、C₁～₄アルキルアミノ、C₁～₄アルキルカルボキサミド、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

₄ アルキルチオウレイル、C₁ ~ ₄ アルキルウレイル、アミノ、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、C₂ ~ ₈ ジアルキルアミノ、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 ジアルキルスルホニアミド、C₁ ~ ₄ アルキルチオウレイル、C₁ ~ ₄ ハロアルコキシ、C₁ ~ ₄ ハロアルキル、C₁ ~ ₄ ハロアルキルスルフィニル、C₁ ~ ₄ ハロアルキルスルホニル、C₁ ~ ₄ ハロアルキル、C₁ ~ ₄ ハロアルキルチオ、ハロゲン、複素環、ヒドロキシリル、ヒドロキシリルアミノ、およびニトロからなる群から選択され；

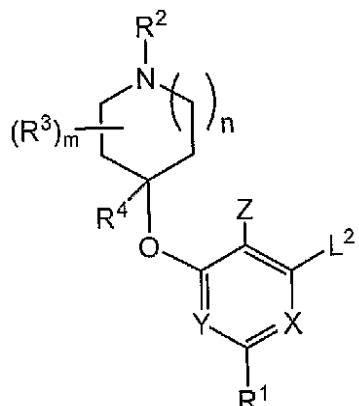
R²³、R²⁴ および R²⁵ は、それぞれ別個に、H または C₁ ~ ₈ アルキルであり；

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 II :

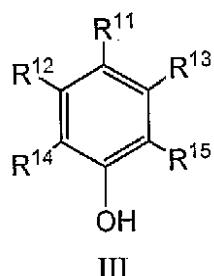
【化 2】



II

の化合物と式 III :

【化 3】



III

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、

L² は、脱離基である、

方法。

【請求項 2】

前記塩が、テトラ(C₁ ~ 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、K₂CO₃ 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、八口である、請求項1に記載の方法。

【請求項11】

L²が、C1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、C_{1～5}アシル、C_{1～5}アシルオキシ、C_{2～6}アルケニル、C_{1～4}アルコキシ、C_{1～8}アルキル、C_{2～6}アルキニル、ホルミル、C_{1～4}ハロアルコキシ、C_{1～4}ハロアルキル、ハログン、ヒドロキシリ、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-R²⁻²であり、R²⁻²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-R²⁻²であり、R²⁻²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】

R¹⁻¹が、C_{1～4}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】

R¹⁻¹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】

R¹⁻²、R¹⁻³、R¹⁻⁴およびR¹⁻⁵が、それぞれ別個に、Hまたはハログンである、請求項1に記載の方法。

【請求項24】

R¹⁻⁵が、Fである、請求項1に記載の方法。

【請求項25】

R¹⁻¹が、C_{1～4}アルキルスルホニルであり；R¹⁻²、R¹⁻³およびR¹⁻⁴が、それぞれ、Hであり；R¹⁻⁵が、ハログンである、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；
R¹は、Hであり；
R²は、-C(O)O-R²であり；
R⁴は、Hであり；
R¹¹は、メチルスルホニルであり；
R¹²、R¹³およびR¹⁴は、それぞれ、Hであり；
R¹⁵は、Fであり；
R²²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。

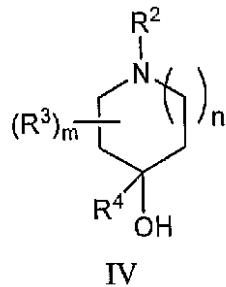
方法。

【請求項27】

前記式IIの化合物が、

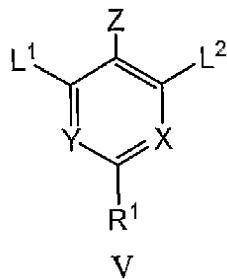
a)式IV：

【化4】



の化合物と式V：

【化5】



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、L¹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II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、C₁~₆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、ハロである、請求項2_7に記載の方法。

【請求項3_4】

L¹が、C1である、請求項2_7に記載の方法。