

【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18年1月5日(2006.1.5)

【公表番号】特表2005-501056(P2005-501056A)

【公表日】平成17年1月13日(2005.1.13)

【年通号数】公開・登録公報2005-002

【出願番号】特願2003-517038(P2003-517038)

【国際特許分類】

C 07 D 307/87 (2006.01)

C 07 D 307/88 (2006.01)

A 61 K 31/343 (2006.01)

A 61 P 25/24 (2006.01)

C 07 B 57/00 (2006.01)

C 07 C 249/12 (2006.01)

C 07 C 251/48 (2006.01)

【F I】

C 07 D 307/87

C 07 D 307/88

A 61 K 31/343

A 61 P 25/24

C 07 B 57/00 3 5 0

C 07 C 249/12

C 07 C 251/48

【手続補正書】

【提出日】平成17年7月28日(2005.7.28)

【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】請求項1

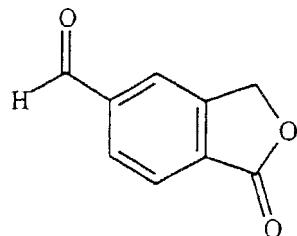
【補正方法】変更

【補正の内容】

【請求項1】

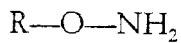
シタロプラムの製造方法において、

(a)式、



(I)

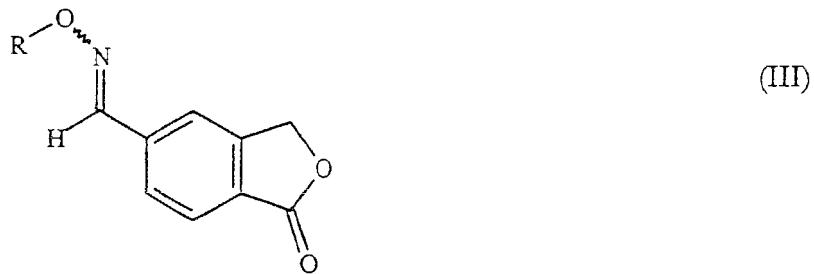
の5-ホルミルフタリドを、式、



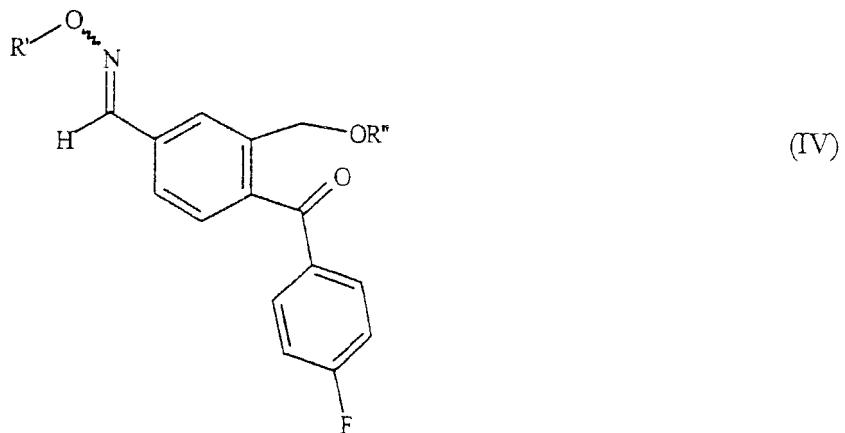
(II)

のヒドロキシリルアミン、ここでRは水素原子(I I a)、又はグリニヤール反応の条件下

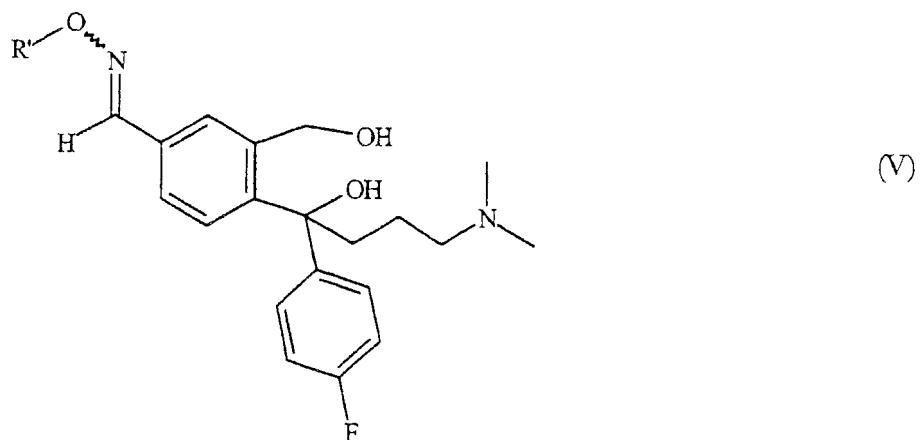
で不活性である置換基 R' (II b) である、で処理すること、  
(b) このようにして得られた式、



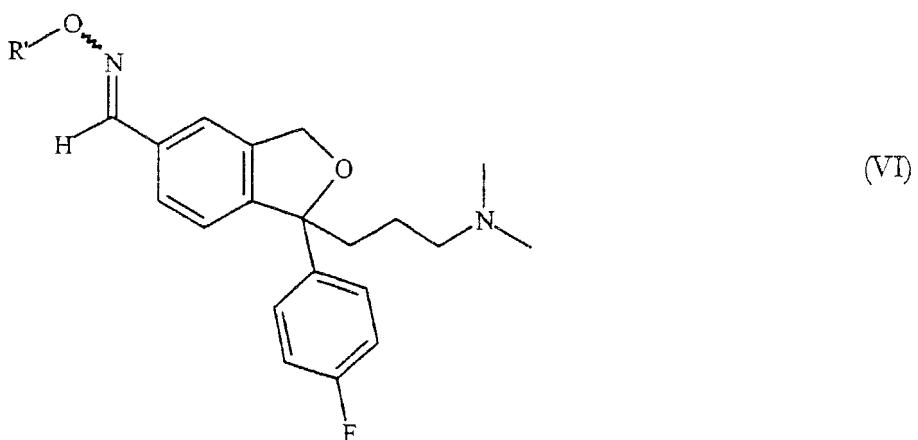
のオキシム、ここで R は上で定義された通りである、を  $R = R'$  (III b) のときはそのまま、又は  $R = H$  (III a) のときは  $R'$  による R の置換後に、4 - フルオロフェニルマグネシウムハライドと反応させること、  
(c) 式、



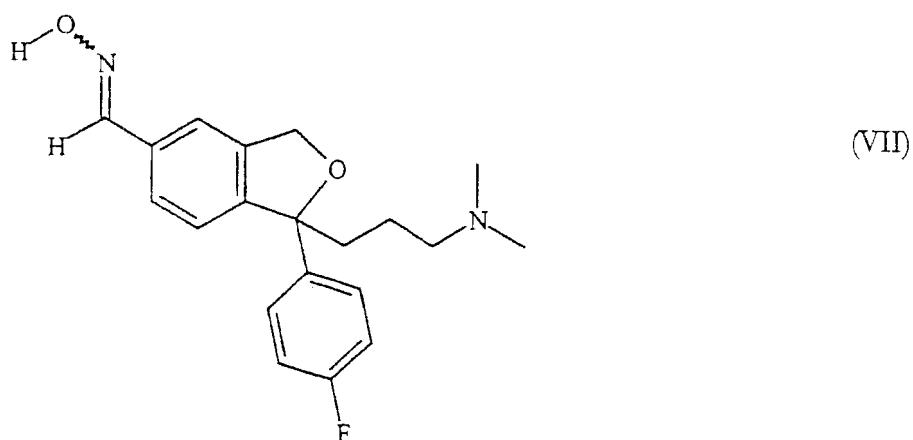
の中間体ケトン、ここで  $R'$  は上で定義された通りであり、 $R''$  は  $MgHal$  (IV a) を表し、ここで  $Hal$  はハロゲン、又は水素 (IV b) である、を [3 - (ジメチルアミノ)プロピル]マグネシウムハライドと反応させること、  
(d) 式、



ここで  $R'$  は上で定義されたとおりである、の中間体ジオールを環化させること、  
(e) 式、



の置換されたオキシムの  $R'$  基、ここで  $R'$  は上で定義された通りである、を除去すること、及び  
(f) 式、



のオキシムの無置換のオキシミノ基をニトリルへと転化して、シタロプラム (A) 又は

その薬学的に許容可能な塩を与えること、あるいは  
(e') 任意的に、R'がトリフェニルメチル又はジフェニルメチルであるとき、式VIのオキシムの置換されたオキシイミノ基をそのまま式、



ここでR'''はC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>のアルキル基、アラルキル基、又はアリール基を表す、の混合酸無水物で処理することによりニトリルへと転化して、シタロプラム(A)又はその薬学的に許容可能な塩を与えること  
を含む方法。

**【手続補正2】**

**【補正対象書類名】**特許請求の範囲

**【補正対象項目名】**請求項12

**【補正方法】**変更

**【補正の内容】**

**【請求項12】**

上記混合物が、1:1.25のモル比の蟻酸及び酢酸無水物から製造されるところの、請求項11に記載の方法。

**【手続補正3】**

**【補正対象書類名】**特許請求の範囲

**【補正対象項目名】**請求項16

**【補正方法】**変更

**【補正の内容】**

**【請求項16】**

Rがトリフェニルメチル又はジフェニルメチルから選択された置換基R'を表すところの、請求項15に記載の化合物。