

【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27日(2008.3.27)

【公開番号】特開2002-255943(P2002-255943A)

【公開日】平成14年9月11日(2002.9.11)

【出願番号】特願2001-50017(P2001-50017)

【国際特許分類】

C 0 7 D 241/04 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 241/04

【手続補正書】

【提出日】平成20年1月11日(2008.1.11)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】明細書

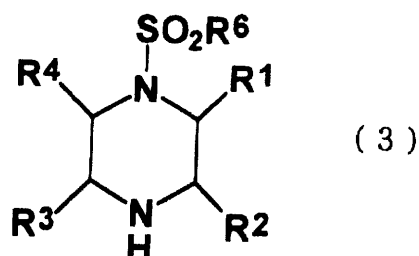
【補正対象項目名】0 0 0 4

【補正方法】変更

【補正の内容】

【 0 0 0 4 】

【化 1 2】



(式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 は同じであっても異なっても良く、i) 水素原子、ii) ハロゲン原子、iii) 炭素数 1 から 4 のアルキル基、iv) 炭素数 1 から 4 のアルコキシ基、v) ニトロ基、vi) シアノ基、vii) カルボキシ基、viii) カルバモイル基、またはix) アルキル基の炭素数が 1 から 4 の N - アルキルカルバモイル基を示し、 R^6 はi) 無置換、または炭素数 1 から 4 のアルキル基、炭素数 1 から 4 のアルコキシ基、ニトロ基もしくはハロゲン基で置換されたアリール基、ii) 無置換、または炭素数 1 から 4 のアルキル基、炭素数 1 から 4 のアルコキシ基、ニトロ基もしくはハロゲン基で置換されたアラルキル基を示す。) で表されるピペラジン誘導体の塩酸塩を製造する方法として、相当するピペラジン誘導体に等モル程度の酸クロライド、あるいはスルホニルクロライドを反応させる方法が知られている。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 0 3 8

【補正方法】変更

【補正の内容】

【 0 0 3 8 】

比較例 4

温度計、滴下ロート、攪拌機を装着した容量 1 0 0 0 m l の反応容器に、ラセミ N - t e r t - ブチル - 2 - ピペラジンカルボキサミド 3 7 . 0 5 (2 0 0 m m o l) とエタノール 3 7 0 . 8 g を仕込んだ。室温下に攪拌して溶解した。滴下ロートに塩化ベンゾイル 2 9 . 5 2 g (2 1 0 m m o l) を仕込み、このものを 6 時間かけて滴下して反応させた

。滴下終了後、同温度下で 1 時間攪拌して熟成した。反応スラリーを約 2 時間かけて 3 まで冷却し、更に 1 時間攪拌を続けた。析出した結晶を遠心濾過し、ケーキを 20.0 g のエタノールで洗浄した。

得られたケーキを乾燥してラセミ 2 - t e r t - ブチルカルボキサミド - 4 - ベンゾイルピペラジン塩酸塩 39.76 g を得た。収率は 61.0 % であった。この結晶の一部を採取し、メタノール中で 1 N - N a O H a q . で中和したのちガスクマトグラフィー分析したところ、原料 N - t e r t - ブチル - 2 - ピペラジンカルボキサミド の含有率は 0.71 % であった。