

【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12月10日(2009.12.10)

【公表番号】特表2008-536836(P2008-536836A)

【公表日】平成20年9月11日(2008.9.11)

【年通号数】公開・登録公報2008-036

【出願番号】特願2008-505592(P2008-505592)

【国際特許分類】

C 07 D 249/08 (2006.01)

【F I】

C 07 D 249/08 5 3 4

【手続補正書】

【提出日】平成21年10月8日(2009.10.8)

【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

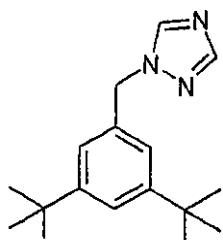
【補正方法】変更

【補正の内容】

【請求項1】

下記式：

【化1】

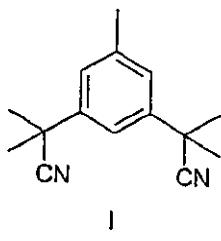


アナストロゾール

のアナストロゾールの調製方法において、

a) 下記式I:

【化2】



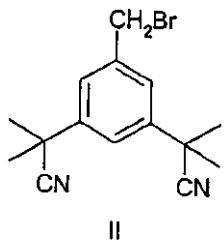
の3,5-bis(2-シアノイソプロピル)トルエンと、アセトニトリル、ジクロロメタンおよ

びクロロベンゼンから成る群から選択される溶媒と、N-プロモコハク酸イミドおよび1,3-ジプロモ-5,5-ジメチルヒダントイントインから成る群から選択される臭素化試薬と、2,2'-アゾビス(2-メチルプロピルニトリル)とを一緒にする工程；

b) 加熱工程；

c) 1,2,4-トリアゾールと、N-メチルピロリジノン、ジメチルホルムアミド、NMPおよびDMFの混合物、ジメチルスルホキシド、DMSOおよびトルエンの混合物、アセトン、ACN、およびテトラヒドロフランから成る群から選択される溶媒と、NaOH、KOH、 $K_2CO_3$ および $Na_2CO_3$ から成る群から選択される塩基と、下記式II：

【化3】



の1,3ベンゼンジアセトニトリル-5-(プロモメチル)-，，，，'-テトラメチルとを、-20より低い温度にて混合する工程；

を含むアナストロゾールの調製方法。

【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3

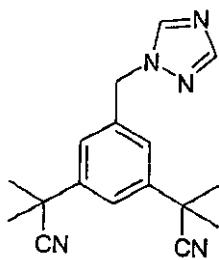
【補正方法】変更

【補正の内容】

【請求項3】

下記式：

【化4】

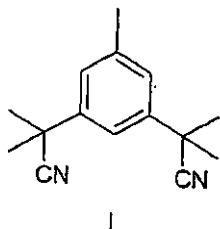


アナストロゾール

のアナストロゾールの調製方法において、

a) 下記式I：

## 【化5】

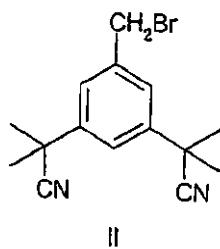


の3,5-bis(2-シアノイソプロピル)トルエンと、アセトニトリル、ジクロロメタンおよびクロロベンゼンから成る群から選択される溶媒と、N-プロモコハク酸イミドおよび1,3ジブロモ-5,5-ジメチルヒダントインから成る群から選択される臭素化試薬と、2,2'-アゾビス(2-メチルプロピオニトリル)とを一緒にする工程；

b) 加熱工程；

c) 1,2,4-トリアゾールと、N-メチルピロリジノン、ジメチルホルムアミド(DMFと称す)、NMPとDMFとの混合物、ジメチルスルホキシド、DMSOとトルエンとの混合物、アセトン、ACN、およびテトラヒドロフランから成る群から選択される溶媒と、NaOH、KOH、 $K_2CO_3$ および $Na_2CO_3$ から成る群から選択される塩基と、下記式II：

## 【化6】



の1,3-ベンゼンジアセトニトリル-5-(ブロモメチル)- , , , ' -テトラメチルとを  
-20 より低い温度にて一緒にする工程；及び

d) 精製する工程；

を含むアナストロゾールの調製方法。

## 【手続補正3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0009

【補正方法】変更

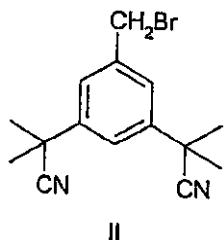
【補正の内容】

【0009】

の3,5-bis(2-シアノイソプロピル)トルエンと、アセトニトリル(ACNと称す)、ジクロロメタン(DCMと称す)、およびクロロベンゼンから成る群から選択される溶媒と、N-プロモコハク酸イミド(NBSと称す)および1,3ジブロモ-5,5-ジメチルヒダントインから成る群から選択される臭素化試薬と、2,2'-アゾビス(2-メチルプロピルニトリル)とを一緒にする工程；加熱工程；1,2,4-トリアゾールとN-メチルピロリジノン(NMPと称す)、ジメチルホルムアミド(DMFと称す)、NMPとDMFとの混合物、ジメチルスルホキシド(DMSOと称す)、DMSOとトルエンとの混合物、アセトン、ACN、およびテトラヒドロフラン(THFと称す)から成る

群から選択される溶媒と、NaOH、KOH、 $K_2CO_3$ 、および $Na_2CO_3$ から成る群から選択される塩基と、そして下記式II:

## 【化5】



の1,3-ベンゼンジアセトニトリル-5-(プロモメチル)- , , ' , ' -テトラメチルとを、-20 より低い温度にて混合する工程；  
を含む調製方法を提供する。

## 【手続補正4】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0012

【補正方法】変更

【補正の内容】

## 【0012】

のアナストロゾールの調製方法を提供し、その方法は、化学式Iの3,5-bis(2-シアノイソプロピル)トルエンと、アセトニトリル(ACNと称す)、ジクロロメタン(DCMと称す)、およびクロロベンゼンから成る群から選択される溶媒と、N-プロモコハク酸イミド(NBSと称す)および1,3ジプロモ-5,5-ジメチルヒダントインから成る群から選択される臭素化試薬と、2,2'-アゾビス(2-メチルプロピルニトリル)とを混合する工程；加熱工程；1,2,4-トリアゾールとN-メチルピロリジノン(NMPと称す)、ジメチルホルムアミド(DMFと称す)、NMPとDMFとの混合液、ジメチルスルホキシド(DMSOと称す)、DMSOとトルエンとの混合液、アセトン、ACN、およびテトラヒドロフラン(THFと称す)から成る群から選択される溶媒と、NaOH、KOH、 $K_2CO_3$ 、および $Na_2CO_3$ から成る群から選択される塩基と、そして化学式IIの1,3-ベンゼンジアセトニトリル-5-(プロモメチル)- , , ' , ' -テトラメチルとを、-20 より低い温度にて混合する工程；そして本明細書の上記精製方法により精製する工程；である。

## 【手続補正5】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0020

【補正方法】変更

【補正の内容】

## 【0020】

の3,5-bis(2-シアノイソプロピル)トルエンと、アセトニトリル(ACNと称す)、ジクロロメタン(DCMと称す)、およびクロロベンゼンから成る群から選択される溶媒と、N-プロモコハク酸イミド(NBSと称す)および1,3ジプロモ-5,5-ジメチルヒダントインから成る群から選択される臭素化試薬と、2,2'-アゾビス(2-メチルプロピオニトリル)とを混合する工程；加熱工程；1,2,4-トリアゾールと、N-メチルピロリジノン(NMPと称す)、ジメチルホルムアミド(DMFと称す)、NMPとDMFとの混合液、ジメチルスルホキシド(DMSOと称す)、DMSOとトルエンとの混合液、アセトン、ACN、およびテトラヒドロフラン(THFと称す)から成る群から選択される溶媒と、NaOH、KOH、 $K_2CO_3$ 、および $Na_2CO_3$ から成る群から選択される

塩基と、そして下記式II：

【手続補正6】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0054

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0054】

のアストロゾールの調製方法において、

化学式Iの3,5-bis(2-シアノイソプロピル)トルエンと、アセトニトリル(ACNと称す)、ジクロロメタン(DCMと称す)、およびクロロベンゼンから成る群から選択される溶媒と、N-ブロモコハク酸イミド(NBSと称す)および1,3ジブロモ-5,5-ジメチルヒダントインから成る群から選択される臭素化試薬と、2,2'-アゾビス(2-メチルブロピオニトリル)とを混合する工程；加熱工程；1,2,4-トリアゾールをN-メチルピロリジノン(NMPと称す)、ジメチルホルムアミド(DMFと称す)、NMPとDMFとの混合液、ジメチルスルホキシド(DMSOと称す)、DMSOとトルエンとの混合液、アセトン、ACN、およびテトラヒドロフラン(THFと称す)から成る群から選択される溶媒と、NaOH、KOH、 $K_2CO_3$ 、および $Na_2CO_3$ から成る群から選択される塩基と、そして化学式IIの1,3-ベンゼンジアセトニトリル-5-(ブロモメチル)-，，，'，'，' -テトラメチルとを-20°の温度にて混合する工程；そして本明細書における精製方法により精製する工程；を含むアストロゾールの調製方法を提供する。