

【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17年3月17日(2005.3.17)

【公表番号】特表2004-518620(P2004-518620A)

【公表日】平成16年6月24日(2004.6.24)

【年通号数】公開・登録公報2004-024

【出願番号】特願2002-523456(P2002-523456)

【国際特許分類第7版】

C 0 7 D 211/70

C 0 7 D 463/00

// C 0 7 M 7:00

【F I】

C 0 7 D 211/70

C 0 7 D 471/04 1 2 2

C 0 7 M 7:00

【手続補正書】

【提出日】平成15年4月28日(2003.4.28)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】特許請求の範囲

【補正方法】変更

【補正の内容】

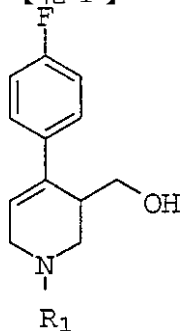
【特許請求の範囲】

【請求項1】

式Iの化合物をラセミ化する方法であって、

a) エナンチオマー的に富化した式I:

【化1】



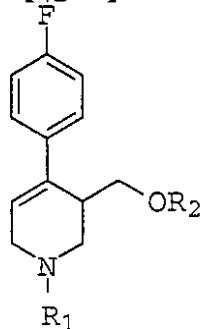
[式中、R₁はアミン保護基を表わす]

の化合物を式II:

R₂X II

[式中、R₂は式R₃SO₂(式中、R₃は任意で置換されているフェニル、C₁₋₆アルキル基またはトリフルオロメチル基を表わす)の基を表わし、Xはハロを表わす]の化合物と反応させて、式III:

【化 2】



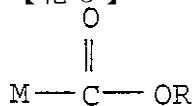
III

[式中、 R_2 は式 R_3SO_2 （式中、 R_3 は任意で置換されているフェニル、 C_{1-6} アルキル基またはトリフルオロメチル基を表わす）の基を表わす]

の化合物を得て；

b) 式IIIの化合物を、式IV：

【化 3】

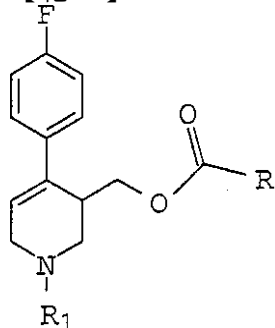


IV

[式中、Mはアルカリ金属を表わし、RはH、 C_{1-6} アルキル基、任意で置換されているフェニルまたは（任意で置換されているフェニル）ヒドロキシ C_{1-6} アルキル基を表わす]

の化合物と反応させて、実質的にラセミ体である式V：

【化 4】



V

[式中、 R_1 およびRは上記と同じ意味を表わす]

の化合物を得て；

c) 式Vの化合物を加水分解剤と反応させて、実質的にラセミ体である式Iの化合物を得る

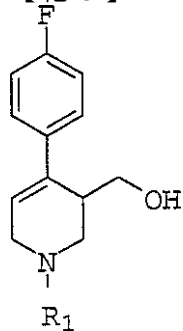
ステップを含んでなる上記方法。

【請求項 2】

式Iの化合物をラセミ化する方法であって、

a) エナンチオマー的に富化した式I：

【化 5】



I

[式中、 R_1 はアミン保護基を表わす]

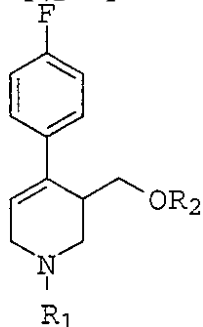
の化合物を式 II :



[式中、 R_2 は式 R_3SO_2 (式中、 R_3 は任意で置換されているフェニル、 C_{1-6} アルキル基またはトリフルオロメチル基を表わす) の基を表し、 X はハロを表わす]

の化合物と反応させて、式 III :

【化 6】

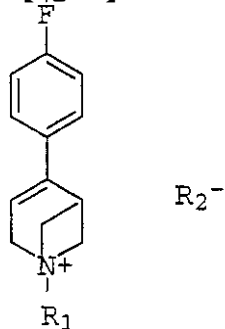


III

[式中、 R_2 は式 R_3SO_2 (式中、 R_3 は任意で置換されているフェニル、 C_{1-6} アルキル基またはトリフルオロメチル基を表わす) の基を表わす]

の化合物を得て、但し、式 III の化合物は、式 IIIa :

【化 7】



IIIa

[式中、 R_1 はアミン保護基を表わし、 R_2^- は R_2 のアニオンである]

の化合物と平衡状態にあり；

b) 式 IIIa の化合物を、式 IV :

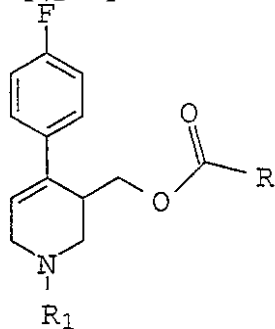
【化 8】



[式中、 M はアルカリ金属を表わし、 R は H 、 C_{1-6} アルキル基、任意で置換されているフェニルまたは (任意で置換されているフェニル) ヒドロキシ C_{1-6} アルキル基を表わす]

の化合物と反応させて、実質的にラセミ体である式 V :

【化 9】



V

[式中、 R_1 および R は上記と同じ意味を表わす]

の化合物を得て；

c) 式 V の化合物を加水分解剤と反応させて、実質的にラセミ体である式 I の化合物を得る

ステップを含んでなる上記方法。

【請求項 3】

アミン保護基が、a) アリル、b) ベンズヒドリル、c) メトキシメチル、d) ベンジルオキシメチル、e) テトラヒドロピラニル、f) 任意で置換されているベンジル基、g) ジ(p-メトキシフェニル)メチル、h) トリフェニルメチル、i) (p-メトキシフェニル)ジフェニルメチル、j) ジフェニル-4-ピリジルメチル、k) メチルもしくはエチルなどの C_{1-6} アルキル基、l) トリフルオロ C_{1-4} アルキル基、m) アルキニル基、または n) p-メトキシベンジルから選ばれる、請求項 1 または 2 に記載の方法。

【請求項 4】

R_3 がメチル、または任意でメチル基、ニトロ基もしくはハロで置換されているフェニルを表わす、請求項 1 ～ 3 のいずれか 1 項に記載の方法。

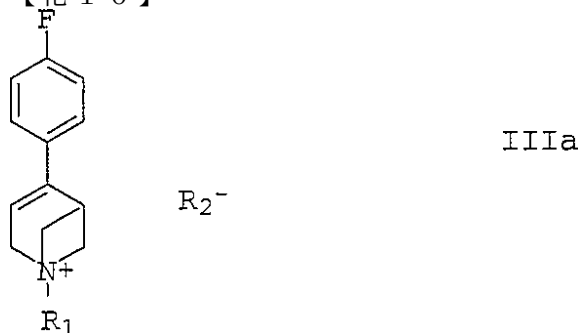
【請求項 5】

加水分解剤が、水酸化ナトリウム水溶液、アンモニア水溶液、炭酸カリウム水溶液、重炭酸カリウム水溶液、重炭酸ナトリウム水溶液、炭酸ナトリウム水溶液、水酸化カリウム、水酸化カリウム水溶液、および水酸化リチウム水溶液の 1 種以上から選ばれる、請求項 1 ～ 4 のいずれか 1 項に記載の方法。

【請求項 6】

式 IIIa:

【化 10】



[式中、 R_1 はアミン保護基を表わし、 R_2 は前記と同じ意味を表わし、好ましくは R_1 はベンジルまたは C_{1-6} アルキル基を表わす] の化合物。