

【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24年10月18日(2012.10.18)

【公表番号】特表2012-505191(P2012-505191A)

【公表日】平成24年3月1日(2012.3.1)

【年通号数】公開・登録公報2012-009

【出願番号】特願2011-530559(P2011-530559)

【国際特許分類】

C 0 7 D 249/04 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 249/04 5 0 6

【手続補正書】

【提出日】平成24年8月31日(2012.8.31)

【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

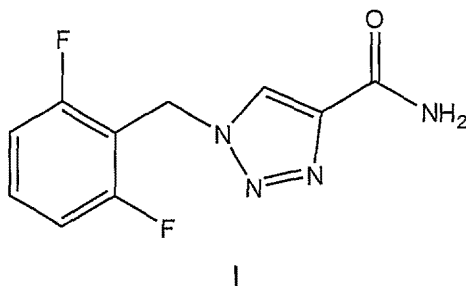
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

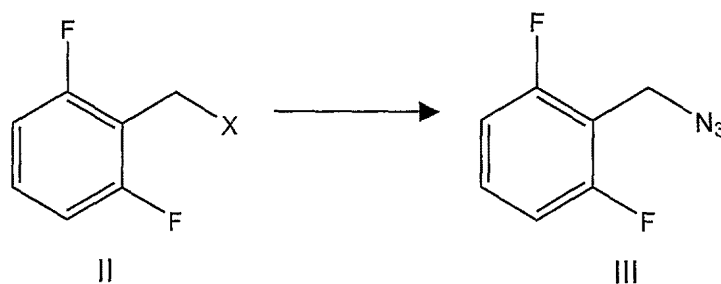
式Iのルフィナマイドの製造方法であって、

【化1】



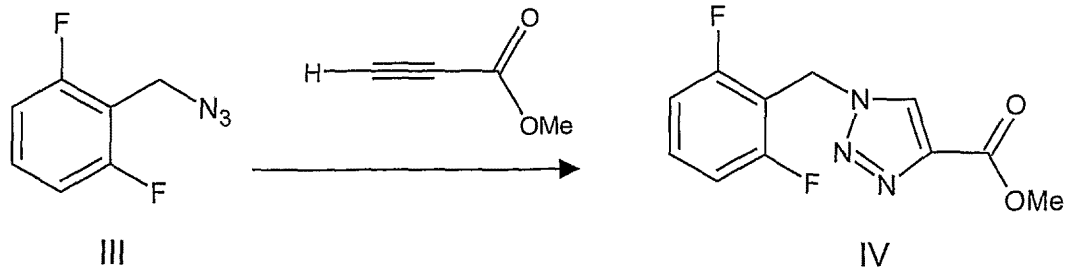
(i) 式IIの2,6-ジフルオロベンジルハライド(式中、Xは、クロリド、ブロミド又はヨロジドである。)をアジドと反応させ、式IIIの2-(アジドメチル)-1,3-ジフルオロベンゼンを得ること;

【化2】



(ii) 式IIIの2-(アジドメチル)-1,3-ジフルオロベンゼンをプロピオール酸メチルと反応させ、式IVの1-(2,6-ジフルオロベンジル)-1H-1,2,3-トリアゾール-4-カルボン酸メチルを

得ること；  
及び  
【化3】



(iii) 式IVの1-(2,6-ジフルオロベンジル)-1H-1,2,3-トリアゾール-4-カルボン酸メチルをアンモニアと反応させ、式Iのルフィナマイドを得ること；を含む、前記製造方法。

【請求項2】

Xがクロリドである、請求項1記載の製造方法。

【請求項3】

Xがプロミドである、請求項1記載の製造方法。

【請求項4】

前記アジドがアルカリ金属アジドである、請求項1、2又は3記載の製造方法。

【請求項5】

前記アルカリ金属アジドがナトリウムアジド又はカリウムアジドである、請求項4記載の製造方法。

【請求項6】

前記アルカリ金属アジドがナトリウムアジドである、請求項4記載の製造方法。

【請求項7】

前記アジドがトリメチルシリルアジドである、請求項1、2又は3記載の製造方法。

【請求項8】

前記アジドがジフェニルホスホリルアジドである、請求項1、2又は3記載の製造方法。

【請求項9】

工程(iii)における前記アンモニアが、アンモニア水の形態である、請求項1～8のいずれか1項記載の製造方法。

【請求項10】

全ての反応工程が、溶媒として水の存在下で行われる、請求項1～9のいずれか1項記載の製造方法。

【請求項11】

工程(i)～(iii)が、式IIIの2-(アジドメチル)-1,3-ジフルオロベンゼンを単離することなく、及び式IVの1-(2,6-ジフルオロベンジル)-1H-1,2,3-トリアゾール-4-カルボン酸メチルを単離することなく行われる、請求項1～10のいずれか1項記載の製造方法。

【請求項12】

ワンポットである、請求項1～11のいずれか1項記載の製造方法。

【請求項13】

ルフィナマイドの製造方法における、プロピオール酸メチルの使用。

【請求項14】

前記方法を溶媒として水中で行う、請求項13記載の使用。

【請求項15】

前記方法がワンポット方法である、請求項13又は14記載の使用。

【請求項16】

前記ルフィナマイドの製造方法が、請求項 1 ~ 1 2 のいずれか 1 項記載の方法である、請求項 1 3、1 4、又は 1 5 記載の使用。