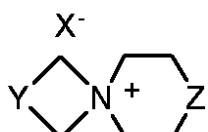


(3)

[式中、Zは、=N-R³、または=CH-R⁴であり、R³は、C₁₋₆アルキル基、C₃₋₇シクロアルキル基、C₅₋₇シクロアルケニル基、C₆₋₁₀アリール基、または5員～10員の単環式もしくは二環式のヘテロアリール基であり、R⁴は、C₁₋₆アルキル基、C₁₋₆アルコキシ基、C₁₋₆アルキルチオ基、C₃₋₇シクロアルキル基、C₃₋₇シクロアルキルオキシ基、C₃₋₇シクロアルキルチオ基、C₅₋₇シクロアルケニル基、C₅₋₇シクロアルケニルオキシ基、C₅₋₇シクロアルケニルチオ基、C₆₋₁₀アリール基、C₆₋₁₀アリールオキシ基、C₆₋₁₀アリールチオ基、5員～10員の単環式もしくは二環式のヘテロアリール基、5員～10員の単環式もしくは二環式のヘテロアリールオキシ基、または5員～10員の単環式もしくは二環式のヘテロアリールチオ基である]で表される化合物を反応することで得られる、式(4)：



(4)

[式中、X⁻は、前記式(1)で表される化合物で定義されるXの対アニオンであり、YおよびZは前記式(1)及び式(3)で表される化合物の定義と同じである]で表される第四級アンモニウム塩の製造方法。

【請求項2】

式(1)で表される化合物と、式(3)で表される化合物を反応する工程において、下記工程(i)および(ii)を含む、請求項1に記載の製造方法：

工程(i)：式(1)で表される化合物と、式(1)で表される化合物に対して0.1～1.0モル倍の式(3)で表される化合物を反応する工程、および

工程(ii)：工程(i)で得られる反応液に、工程(i)における量と合わせて式(1)で表される化合物に対して1.5～15モル倍になるように残余分の式(3)で表される化合物を添加し、反応する工程。

【請求項3】

式(1)で表される化合物と式(3)で表される化合物を反応する工程において、下記工程(i)および(ii)を含む、請求項1に記載の製造方法：

工程(i)：式(1)で表される化合物の総添加量に対して、まず0.1～1.0モル倍の式(1)で表される化合物と、式(1)で表される化合物の総添加量に対して0.1～1.0モル倍の式(3)で表される化合物とを反応する工程、および

工程(ii)：工程(i)で得られる反応液に、残余分の式(1)で表される化合物と、式(1)で表される化合物の総添加量に対して総添加量が1.5～15モル倍になるように残余分の式(3)で表される化合物を添加し、反応する工程。

【請求項4】

式(1)で表される化合物の総添加量に対して、0.1～1.0モル倍の無機塩の存在下反応を行う、請求項2または3に記載の製造方法。

【請求項5】

無機塩が炭酸カリウムである、請求項4に記載の製造方法。

【請求項6】

無機塩の添加量が、式(1)で表される化合物の総添加量に対して0.1～0.3モル倍である、請求項4または5に記載の製造方法。

【請求項 7】

工程 (i) における式 (3) で表される化合物の添加量が、式 (1) で表される化合物の総添加量に対して 0.1 ~ 0.5 モル倍である、請求項 2 ~ 6 のいずれか一項に記載の製造方法。

【請求項 8】

工程 (ii) における式 (3) で表される化合物の総添加量が、式 (1) で表される化合物の総添加量に対して 1.8 ~ 5 モル倍である、請求項 2 ~ 7 のいずれか一項に記載の製造方法。

【請求項 9】

X が各々独立して、C₁ ~ C₆ アルキルスルホニルオキシ基、または C₆ ~ C₁₀ アリールスルホニルオキシ基である、請求項 1 ~ 8 のいずれか一項に記載の製造方法。

【請求項 10】

X がメタンスルホニルオキシ基である、請求項 9 に記載の製造方法。

【請求項 11】

Y が式 (2a) で表される基である、請求項 1 ~ 10 のいずれか一項に記載の製造方法。

【請求項 12】

m が 2 であり、n が 0 である、請求項 11 に記載の製造方法。

【請求項 13】

Z が =N-R³ である、請求項 1 ~ 12 のいずれか一項に記載の製造方法。

【請求項 14】

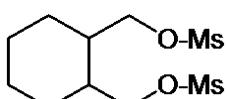
R³ が 5 員 ~ 10 員の単環式もしくは二環式のヘテロアリール基である、請求項 13 に記載の製造方法。

【請求項 15】

R³ が 1,2-ベンゾイソチアゾール-3-イルである、請求項 14 に記載の製造方法。

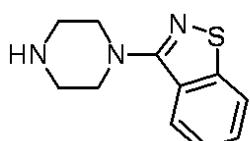
【請求項 16】

式 (1) で表される化合物が



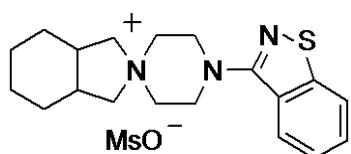
であり、

式 (3) で表される化合物が



であり、

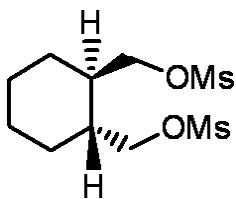
式 (4) で表される第四級アンモニウム塩が



である、請求項 1 ~ 15 のいずれか一項に記載の製造方法。

【請求項 17】

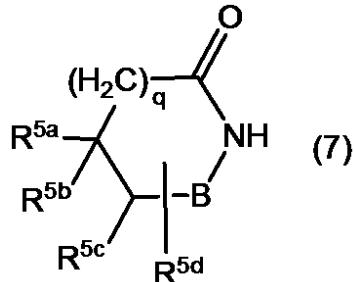
式 (1) で表される化合物が



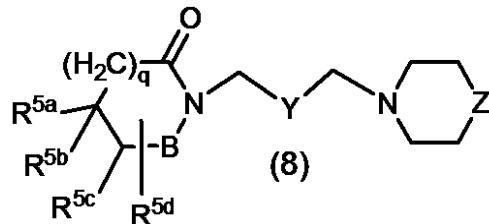
である、請求項 1 ~ 16 のいずれか一項に記載の製造方法。

【請求項 18】

更に、請求項 1 ~ 17 のいずれか一項に記載の製造方法にて得られた式(4)の第四級アンモニウム塩と、下記式(7)：



[式中、Bはカルボニル基またはスルホニル基であり、R^{5a}、R^{5b}、R^{5c}、およびR^{5d}は各々独立して水素原子あるいはC₁~₄アルキル基であるが、ただし、R^{5a}とR^{5b}あるいはR^{5a}とR^{5c}が一緒にになって炭化水素環を、またはR^{5a}とR^{5c}が一緒にになって芳香族炭化水素環を形成してもよく、当該炭化水素環はC₁~₄アルキレンまたは酸素原子で架橋されていてもよく、当該C₁~₄アルキレンおよび炭化水素環は少なくとも一つのC₁~₄アルキルで置換されていてもよく、qは、0または1である]で表される化合物とを、固体無機塩基の存在下に反応することで得られる、式(8)：



[式中、B、R^{5a}、R^{5b}、R^{5c}、R^{5d}及びqは、式(7)で表される化合物の定義と同じであり、Y及びZは、請求項1と同じである]で表される化合物またはその酸付加塩を製造することを特徴とする、請求項1~17のいずれか一項に記載の製造方法。

【請求項 19】

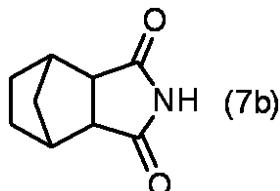
Bがカルボニル基である、請求項18に記載の製造方法。

【請求項 20】

R^{5a}およびR^{5c}が一緒にになって炭化水素環を形成し(該環はC₁~₄アルキレンで架橋されていてもよい)、R^{5b}およびR^{5d}が共に水素原子である、請求項18または19に記載の製造方法。

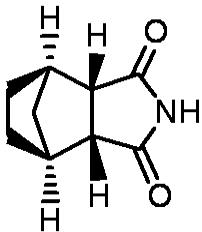
【請求項 21】

式(7)で表される化合物が、下記式(7b)



で表される化合物である、請求項20に記載の製造方法。

【請求項 22】

式(7)で表される化合物がである、請求項 18～21 のいずれか一項に記載の製造方法。

【請求項 23】

式(8)で表される化合物が、(3aR, 4S, 7R, 7aS)-2-[(1R, 2R)-2-[(1, 2-ベンゾイソチアゾール-3-イル)ピペラジン-1-イルメチル]シクロヘキシルメチル]ヘキサヒドロ-4, 7-メタノ-2H-イソインドール-1, 3-ジオンである、請求項18～22のいずれか一項に記載の製造方法。

【請求項 24】

更に、請求項 18～23 のいずれか一項に記載の製造方法にて得られた式(8)の化合物を含む反応液に、脂肪族炭化水素系溶媒および/またはアルコール系溶媒を加えることにより、式(8)の化合物を結晶として取り出すことを特徴とする、請求項 18～23 のいずれか一項に記載の製造方法。

【請求項 25】

溶媒が、アルコール系溶媒である、請求項 24 に記載の製造方法。

【請求項 26】

アルコール系溶媒が、メタノール、エタノール、および/またはイソプロパノールである、請求項 25 に記載の製造方法。

【請求項 27】

式(8)の化合物を製造する反応における固体無機塩基が、アルカリ金属炭酸塩、アルカリ土類金属塩、および/またはアルカリ金属炭酸水素塩である、請求項 18～23 のいずれか一項に記載の製造方法。

【請求項 28】

固体無機塩基が、炭酸カリウムである、請求項 27 に記載の製造方法。

【請求項 29】

分子内に炭酸骨格を有する、炭酸カリウムとの反応由来の副生成物の生成率が、3%を越えないことを特徴とする、請求項 28 に記載の製造方法。

【請求項 30】

副生成物の生成率が、式(4)の第四級アンモニウム塩の製造後において 1.3% を超えず、かつ式(8)の化合物の製造後において 1.9% を超えないことを特徴とする、請求項 29 に記載の製造方法。