

【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5月26日(2005.5.26)

【公開番号】特開2002-121161(P2002-121161A)

【公開日】平成14年4月23日(2002.4.23)

【出願番号】特願2000-285068(P2000-285068)

【国際特許分類第7版】

C 0 7 C 33/46

C 0 7 C 29/147

C 0 7 C 43/174

C 0 7 C 67/287

C 0 7 C 69/16

C 0 7 C 69/28

C 0 7 D 307/87

【F I】

C 0 7 C 33/46

C 0 7 C 29/147

C 0 7 C 43/174

C 0 7 C 67/287

C 0 7 C 69/16

C 0 7 C 69/28

C 0 7 D 307/87

【手続補正書】

【提出日】平成16年7月21日(2004.7.21)

【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

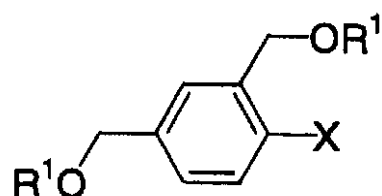
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式[II]

【化1】



[II]

(式中、 $R^1$  は炭素数2から5であるアルカノイル基、炭素数1から5であるアルキル基、テトラヒドロピラン-2-イル基、アルコキシ基の炭素数が1から5であるアルコキシメチル基、アルコキシ基の炭素数が1であるかもしくは3から10である1-アルコキシエチル基、または各アルキル基の炭素数が1から5であるトリアルキルシリル基を示し、 $X$  は塩素原子、臭素原子またはヨウ素原子を示す)で表される化合物。

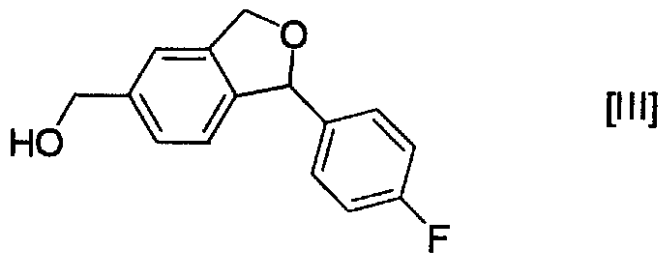
【請求項2】

R<sup>1</sup> がアセチル基であり、かつ X が臭素原子である請求項 1 記載の化合物。

【請求項 3】

式 [III]

【化 2】

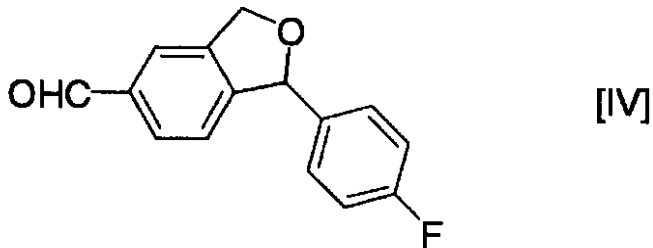


で表される化合物。

【請求項 4】

式 [IV]

【化 3】

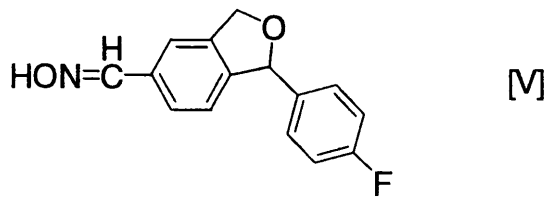


で表される化合物。

【請求項 5】

式 [V]

【化 4】

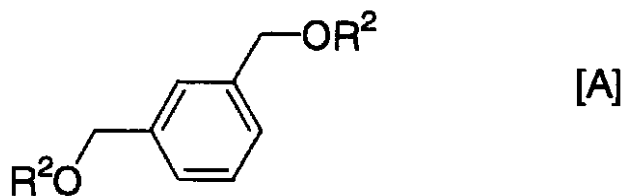


で表されるオキシム化合物。

【請求項 6】

式 [A]

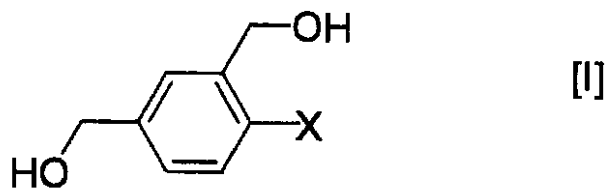
【化 5】



(式中、R<sup>2</sup> は炭素数 2 から 5 であるアルカノイル基を示す)

で表される化合物を、塩素化、臭素化またはヨウ素化のいずれかに付した後、脱アシル化することを特徴とする、式 [I]

【化 6】



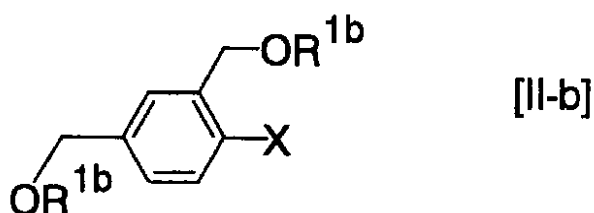
(式中、Xは塩素原子、臭素原子またはヨウ素原子を示す)

で表される化合物の製造方法。

【請求項 7】

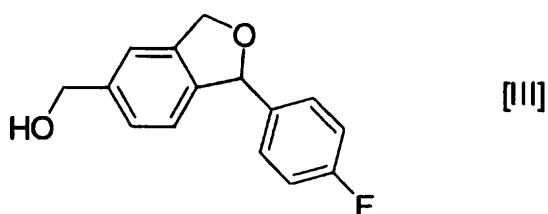
式 [II-b]

【化 7】



(式中、 $R^{1b}$ は炭素数1から5であるアルキル基、テトラヒドロピラン-2-イル基、アルコキシ基の炭素数が1から5であるアルコキシメチル基、アルコキシ基の炭素数が1から10である1-アルコキシエチル基、または各アルキル基の炭素数が1から5であるトリアルキルシリル基を示し、Xは塩素原子、臭素原子またはヨウ素原子を示す)で表される化合物を、(1)グリニャール試薬またはリチウム化合物に変換後、(2)これをパラフルオロベンズアルデヒドとカップリングさせ、さらに(3)得られたカップリング化合物を $R^{1b}$ の脱保護及び環化に付すことを特徴とする、式 [III]

【化 8】

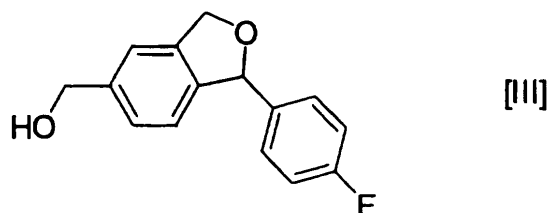


で表される化合物の製造方法。

【請求項 8】

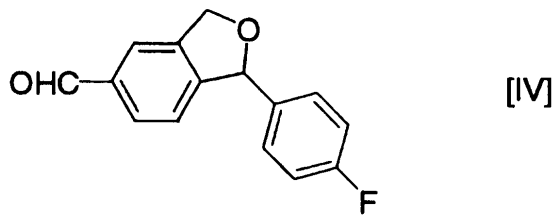
式 [III]

【化 9】



で表される化合物を酸化することを特徴とする、式 [IV]

【化 1 0】

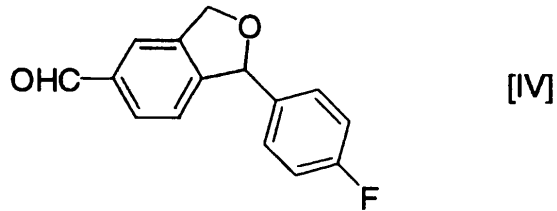


で表される化合物の製造方法。

【請求項 9】

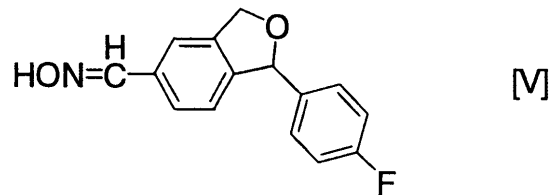
式 [IV]

【化 1 1】



で表される化合物を、ヒドロキシルアミンまたはその鉱酸塩と反応させることを特徴とする、式 [V]

【化 1 2】

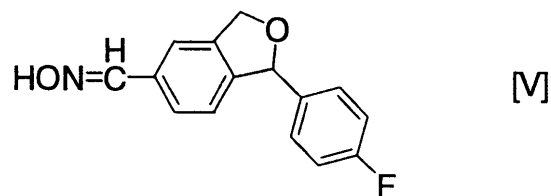


で表されるオキシム化合物の製造方法。

【請求項 10】

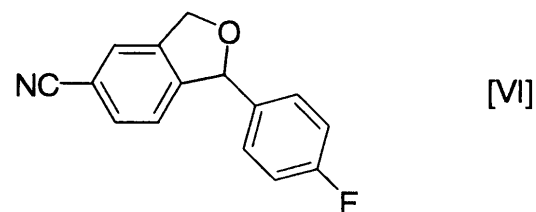
式 [V]

【化 1 3】



で表されるオキシム化合物を脱水することを特徴とする、式 [VI]

【化 1 4】

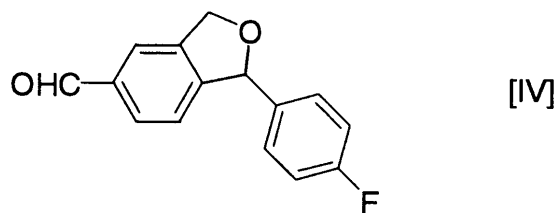


で表される 5 - フタランカルボニトリル化合物の製造方法。

【請求項 1 1】

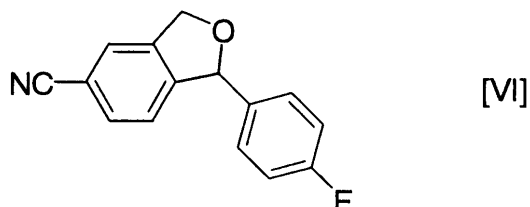
式 [IV]

【化 1 5】



で表される化合物を、ヒドロキシルアミンまたはその鉱酸塩と反応後、脱水させることを特徴とする、式 [VI]

【化 1 6】



で表される 5 - フタランカルボニトリル化合物の製造方法。

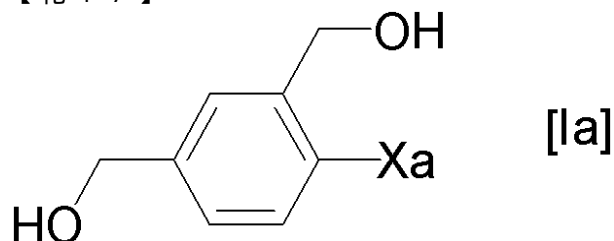
【請求項 1 2】

請求項 1 1 記載の方法で得られた式 [VI] で表される 5 - フタランカルボニトリル化合物を 3 - (ジメチルアミノ) プロピルハライドと反応させることを特徴とする、シタロプラムの製造方法。

【請求項 1 3】

( 1 ) 式 [Ia]

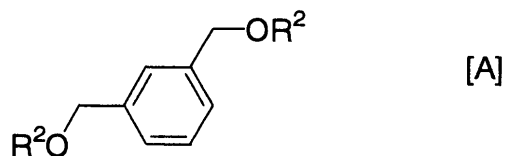
【化 1 7】



( 式中、Xa は塩素原子またはヨウ素原子を示す )

で表される化合物のヒドロキシル基を、炭素数 1 から 5 であるアルコキシル基、テトラヒドロピラン - 2 - イルオキシ基、アルコキシル基の炭素数が 1 から 5 であるアルコキシメトキシ基、アルコキシル基の炭素数が 1 から 10 である 1 - アルコキシエトキシ基、または各アルキル基の炭素数が 1 から 5 であるトリアルキルシリルオキシ基に変換するか、または ( 2 ) 式 [A]

【化 1 8】

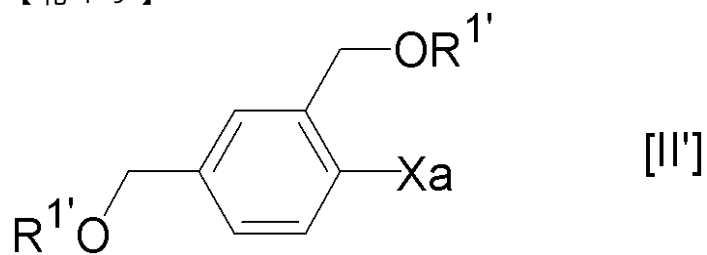


( 式中、R<sup>2</sup> は炭素数 2 から 5 であるアルカノイル基を示す )

で表される化合物を、塩素化またはヨウ素化のいずれかに付すことを特徴とする、式 [II']

1

【化 19】



[II']

(式中、 $\text{R}^{1'}$  は炭素数 2 から 5 であるアルカノイル基、炭素数 1 から 5 であるアルキル基、テトラヒドロピラン - 2 - イル基、アルコキシル基の炭素数が 1 から 5 であるアルコキシメチル基、アルコキシル基の炭素数が 1 から 10 である 1 - アルコキシエチル基、または各アルキル基の炭素数が 1 から 5 であるトリアルキルシリル基を示し、X a は塩素原子またはヨウ素原子を示す)

で表される化合物の製造方法。