

【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22年12月16日(2010.12.16)

【公表番号】特表2002-534423(P2002-534423A)

【公表日】平成14年10月15日(2002.10.15)

【出願番号】特願2000-592283(P2000-592283)

## 【國際特許分類】

C 0 7 D 317/46 (2006.01)

C 0 7 D 317/54 (2006-01)

〔 F T 〕

C 0 7 D 317/46

C 0 7 D 317/54

### 【譯訛訂正書】

【提出日】平成22年10月6日(2010.10.6)

### 【譯訛訂正 1】

### 【訂正對象書類名】明細書

### 【訂正対象項目名】特許請求の範囲

## 【訂正方法】変更

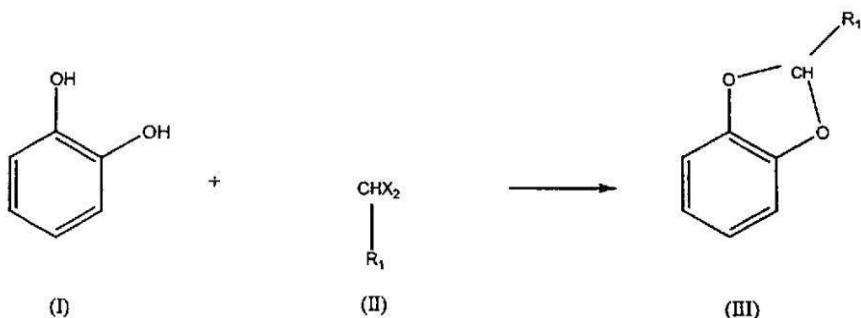
## 【訂正の内容】

## 【特許請求の範囲】

【請求項1】 5-( -ヒドロキシアルキル)ベンゾ[1,3]ジオキソールを合成する方法において、

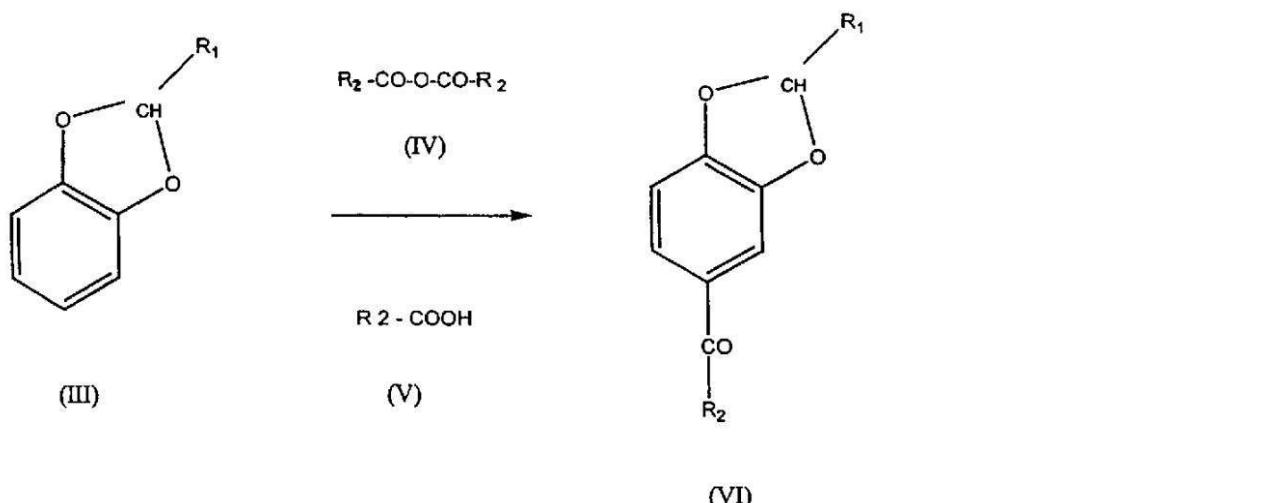
a) 双極性非プロトン性溶媒中、70 ~ 190 の温度で、1,2-ジヒドロキシベンゼン(ピロカテキン)(I)を、式(II)(式中、R<sub>1</sub>はH、C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub>の直鎖又は枝分れのアルキル基から選ばれ、Xは塩素、フッ素、臭素、ヨウ素、及びC<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub>の直鎖又は枝分れのアルコキシ基から選ばれる)の化合物と反応させて、式(III)(式中、R<sub>1</sub>は上述の意義を有する)の生成物を得て、

### 【化 1】



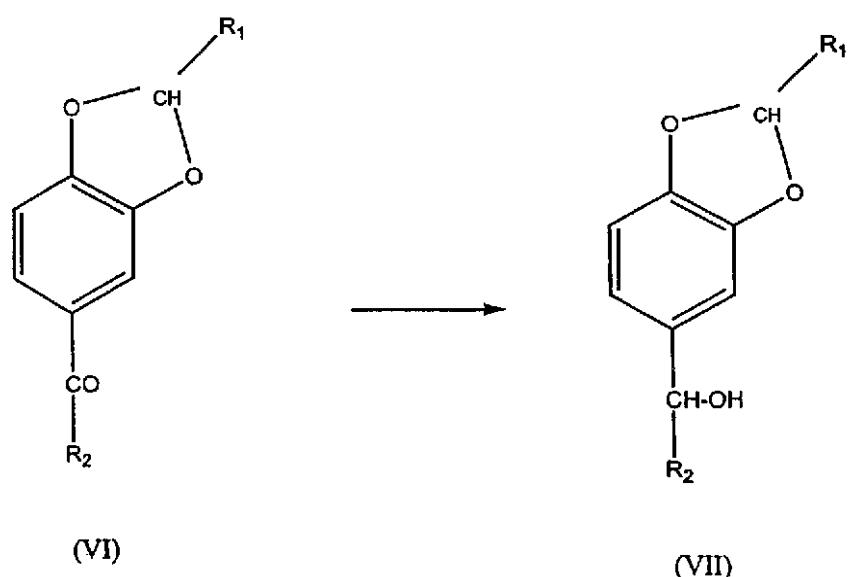
b) アシル化触媒の存在下、化合物(III)を式(V)の脂肪族無水物又は式(V)の脂肪酸(式中、R<sub>2</sub>はC<sub>1</sub>~C<sub>19</sub>の直鎖又は枝分れのアルキル基である)と反応させて、式(VI)(式中、R<sub>1</sub>及びR<sub>2</sub>は上述の意義を有する)の化合物を得て、

【化 2】



c) 化合物 (VI) を還元して、式 (VII) の 5 - ( - ヒドロキシアルキル ) ベンゾ [ 1 , 3 ] ジオキソールを得る、

【化 3】



諸工程を含む、上記合成方法。

【請求項 2】 反応 a ) で使用する双極性非プロトン性溶媒が、  $\text{N}, \text{N}$  - ジメチルホルムアミド、  $\text{N}, \text{N}$  - ジメチルアセトアミド及びジメチルスルホキシドから選ばれる請求項 1 に記載の方法。

【請求項 3】 反応 a ) はヨウ素塩の存在下で行う請求項 1 に記載の方法。

【請求項 4】 反応 b ) は、  $\text{HClO}_4$  、  $\text{ZnO}$  、  $\text{ZnCl}_2$  、  $\text{FeCl}_2$  、  $\text{FeCl}_3$  、  $\text{FeSO}_4$  、  $\text{Fe}_2(\text{SO}_4)_3$  、  $\text{FeO}$  、  $\text{Fe}_2\text{O}_3$  、  $\text{H}_3\text{PO}_4$  及びポリリン酸から選ばれる化合物によって触媒作用を受ける請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の方法。

【請求項 5】 反応 b ) は不活性溶媒の存在下で行う請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の方法。

【請求項 6】 反応 b ) で、ベンゾジオキソール / 酸 (V) のモル比が 5 : 1 ~ 0 . 5 : 1 である請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の方法。

【請求項 7】 反応 b ) で、ベンゾジオキソール / 無水物 (IV) のモル比が 3 : 1 ~ 1 : 1 である請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の方法。

【請求項 8】 反応 b ) から得られる反応混合物を再循環させる請求項 1 ~ 7 のいずれか

1 項に記載の方法。

【請求項 9】 請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の方法に続いて、更に、式 (VII) の誘導体を還元して、5 - アルキルベンゾ [1, 3] ジオキソールを形成する方法。

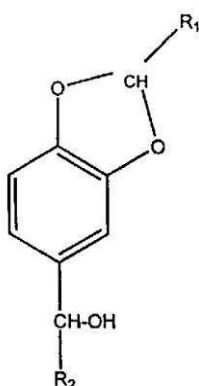
【請求項 10】 式 (VII) の誘導体が 5 - (- ヒドロキシプロピル) ベンゾ [1, 3] ジオキソールであり、5 - アルキルベンゾ [1, 3] ジオキソールが 5 - プロピルベンゾ [1, 3] ジオキソール (ジヒドロサフロール) である請求項 9 に記載の方法。

【請求項 11】 請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の方法に続いて、更に、式 (VII) の誘導体を脱水して、5 - (1 - アルケニル) ベンゾ [1, 3] ジオキソールを形成する方法。

【請求項 12】 式 (VII) の誘導体が 5 - (- ヒドロキシプロピル) ベンゾ [1, 3] ジオキソールであり、5 - (1 - アルケニル) ベンゾ [1, 3] ジオキソールが 5 - (1 - プロペニル) ベンゾ [1, 3] ジオキソール (イソサフロール) である請求項 11 に記載の方法。

【請求項 13】 式 (VII) の化合物。

【化 4】



(VIII)

(式中、R<sub>1</sub> は C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> の直鎖又は枝分れのアルキル基から選ばれ、R<sub>2</sub> は C<sub>1</sub> ~ C<sub>9</sub> の直鎖又は枝分れのアルキル基から選ばれる)

【請求項 14】 R<sub>1</sub> がメチル基、エチル基、n - プロピル基又はイソプロピル基を示す請求項 13 に記載の化合物。

【誤訳訂正 2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0013

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0013】

(発明の詳細な記述)

本発明の主題は、5 - (- ヒドロキシアルキル) ベンゾ [1, 3] ジオキソールを合成するための新規な方法である。この方法は、

a) 双極性非プロトン性溶媒中、70 ~ 190 の温度で、1, 2 - ヒドロキシベンゼン (ピロカテキン) (I) を、式 (II) (式中、R<sub>1</sub> は H 及び C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> の直鎖又は枝分れのアルキル基から選ばれ、X は塩素、フッ素、臭素、ヨウ素及び C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> の直鎖又は枝分れのアルコキシ基から選ばれる) の化合物と反応させて、式 (III) (式中、R<sub>1</sub> は上述の意義を有する) の生成物を得て、

【誤訳訂正 3】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0017

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0017】

反応a)は、双極性非プロトン性溶媒中で行う。この種の好ましい溶媒は、N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド及びジメチルスルホキシドである。

【誤訳訂正4】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0025

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0025】

好ましい具体例で、反応a)は、次のように実施される：化合物(II)を、双極性非プロトン性溶媒及び無機塩基(又はエステル交換反応触媒)と混合する。得られた混合物を還流温度まで加熱し、次いで、ピロカテキンを添加する。この添加は、ピロカテキン、誘導体(II)及び双極性非プロトン性溶媒を混合することによって得られる液状混合物を滴下することによって行うことが好ましい。