

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局(43) 国際公開日
2007 年 8 月 30 日 (30.08.2007)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2007/097279 A1

(51) 国際特許分類:

C07D 261/20 (2006.01) C07D 311/14 (2006.01)
C07C 67/303 (2006.01) C07B 61/00 (2006.01)
C07C 69/738 (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2007/052953

(22) 国際出願日: 2007 年 2 月 19 日 (19.02.2007)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:

特願2006-043777 2006 年 2 月 21 日 (21.02.2006) JP
特願2006-121582 2006 年 4 月 26 日 (26.04.2006) JP
特願2006-121601 2006 年 4 月 26 日 (26.04.2006) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 富山化学工業株式会社 (TOYAMA CHEMICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒1600023 東京都新宿区西新宿三丁目 2 番 5 号 Tokyo (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 米澤 健治 (YONEZAWA, Kenji) [JP/JP]; 〒9308508 富山県富山市下奥井二丁目 4 番 1 号 富山化学工業株式会社 富山事業所内 Toyama (JP). 高松 保 (TAKAMATSU, Tamotsu) [JP/JP]; 〒9308508 富山県富山市下奥井二丁目 4 番 1 号 富山化学工業株式会社 富山事業所内 Toyama (JP). 青木 直克 (AOKI, Naokatu) [JP/JP]; 〒9308508 富山県富山市下奥井二丁目 4 番 1 号 富山化学工業株式会社 富山事業所内 Toyama (JP). 橋本 智宏 (HASHIMOTO, Tomohiro) [JP/JP]; 〒9308508 富山県富山市下奥井二丁目 4 番 1 号 富山化学工業株式会社 富山事業所内 Toyama (JP).

業株式会社 富山事業所内 Toyama (JP). 竹林 正弘 (TAKEBAYASHI, Masahiro) [JP/JP]; 〒9308508 富山県富山市下奥井二丁目 4 番 1 号 富山化学工業株式会社 富山事業所内 Toyama (JP). 鈴木 敬亮 (SUZUKI, Yoshiaki) [JP/JP]; 〒9308508 富山県富山市下奥井二丁目 4 番 1 号 富山化学工業株式会社 富山事業所内 Toyama (JP). 大西 裕司 (OONISHI, Yuji) [JP/JP]; 〒9308508 富山県富山市下奥井二丁目 4 番 1 号 富山化学工業株式会社 富山事業所内 Toyama (JP).

(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, LY, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SV, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

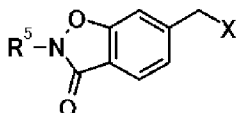
添付公開書類:

— 国際調査報告書

2 文字コード及び他の略語については、定期発行される各 PCT ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: PROCESS FOR PRODUCTION OF 3-[5-[4-(CYCLOPENTYLOXY)-2-HYDROXYBENZOYL]-2-[(3-HYDROXY-1,2-BEZISOXAZOL-6-YL)METHOXY]PHENYL]PROPIONATE ESTER AND INTERMEDIATE FOR THE PROCESS

(54) 発明の名称: 3-〔5-〔4-(シクロペンチルオキシ)-2-ヒドロキシベンゾイル]-2-〔(3-オキソ-2-置換-2, 3-ジヒドロ-1, 2-ベンズイソオキサゾール-6-イル)メトキシ〕フェニル〕プロピオン酸エステルの製造法およびその中間体



(57) Abstract: Disclosed is a production process using, as an intermediate, a 6-(halomethyl)-1,2-benzisoxazol-3(2H)-one derivative represented by the general formula: Wherein R⁵ represents a methyl group substituted by at least one phenyl group which may be substituted, or an oxygenated heterocyclic ring which may be substituted; and X represents a halogen atom. The process is useful for the production of 3-[5-[4-(cyclopentyloxy)-2-hydroxybenzoyl]-2-[(3-hydroxy-1,2-benzisoxazol-6-yl)methoxy]phenyl]propionic acid, which is useful as an anti-rheumatic agent, in a high yield and in a safe and simple manner.

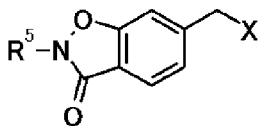
[続葉有]

WO 2007/097279 A1



(57) 要約:

一般式



「式中、R⁵は、一つ以上の置換されていてもよいフェニル基で置換されているメチル基または置換されていてもよい含酸素複素環式基を;Xは、ハロゲン原子を示す。」で表される6-(ハロメチル)-1,2-ベンズイソオキサゾール-3(2H)-オン誘導体を中間体とする製造法は、抗リウマチ剤として有用な3-{5-[4-(シクロペンチルオキシ)-2-ヒドロキシベンゾイル]-2-[(3-ヒドロキシ-1,2-ベンズイソオキサゾール-6-イル)メトキシ]フェニル}プロピオン酸を高収率で安全に容易に製造する方法として有用である。