(12) 特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局

(43) 国際公開日
2007 年11 月1 日 (01.11.2007)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2007/122744 A1

(51) 国際特許分類:
C07D 209/52 (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2006/313355

(22) 国際出願日: 2006 年6 月28 日 (28.06.2006)

(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2006-113074 2006 年4 月17 日 (17.04.2006) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 住友化学株式会社 (SUMITOMO CHEMICAL COMPANY, LIMITED) [JP/JP]; 〒1048260 東京都中央区新川二丁目２７番１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): 平田 紀彦 (HIRATA, Norihiko) [JP/JP]; 〒5650836 大阪府吹田市佐井寺４−３３−１１ Osaka (JP). 植村 利次 (UEMURA, Toshitsugi) [JP/JP]; 〒5610802 大阪府豊中市曽根東町２−１０−３−３５８ Osaka (JP). 牛尾 英樹 (USHIO, Hideki) [JP/JP]; 〒5670841 大阪府茨木市桑田町２−１−２２５ Osaka (JP).

(74) 代理人: 榎本 雅之, 外(ENOMOTO, Masayuki et al.); 〒5418550 大阪府大阪市中央区北浜四丁目５番３３号 住友化学知的財産センター株式会社内 Osaka (JP).

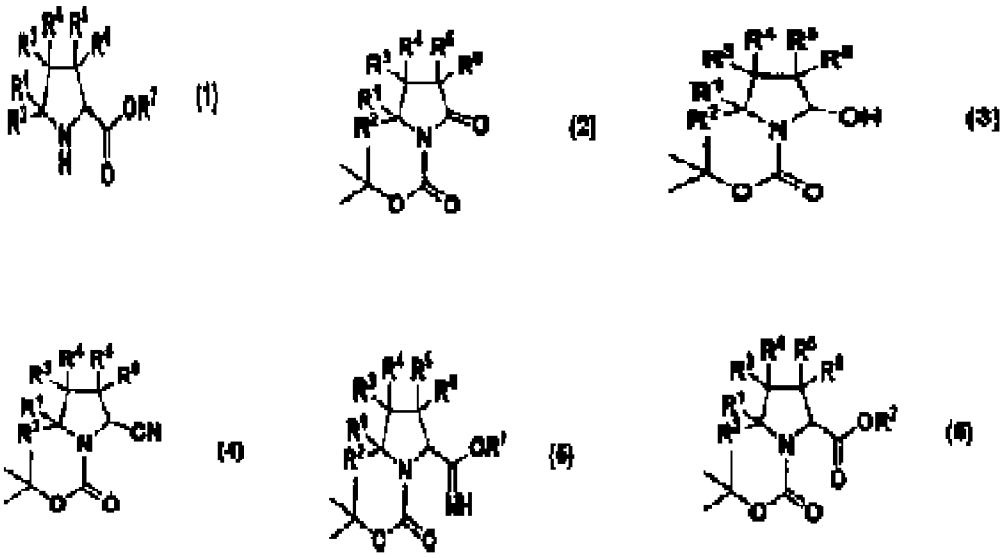
(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, LY, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA,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

[続葉有]

(54) **Title:** PROCESS FOR PRODUCING POLYCYCLIC PROLINE DERIVATIVE OR ACID ADDUCT SALT THEREOF

(54) 発明の名称: 多環式プロリン誘導体又はその酸付加塩の製造方法



(57) **Abstract:** A process for producing proline derivatives of the formula (1) or acid adduct salts thereof, comprising the step of reacting N-protected pyrrolidinones of the formula (2) with reducing agents to thereby obtain N-protected pyrrolidinols of the formula (3) (step A); the step of reacting the N-protected pyrrolidinols obtained in the step A with cyanating agents to thereby obtain N-protected cyanopyrrolidines of the formula (4) (step B); the step of reacting the N-protected cyanopyrrolidines obtained in the step B with alcohols and bases to thereby obtain imidates of the formula (5) and treating the imidates with acids to thereby obtain N-protected prolines of the formula (6) (step C); and the step of treating the N-protected prolines obtained in the step C with acids (step D). (1)-(6) In the formulae, any two out of R^1, R^2, R^3, R^4, R^5 and R^6 are bonded with each other to thereby form an optionally substituted C_1-C_4 polymethylene; and R^7 is an optionally substituted C_1-C_{10} linear alkyl, etc.

[続葉有]

WO 2007/122744 A1

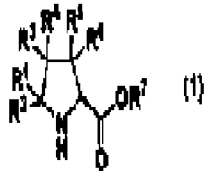
IS, IT, LT, LU, LV, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

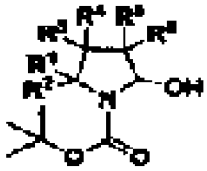
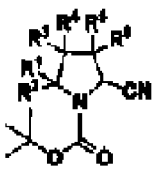
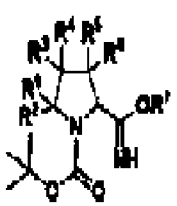
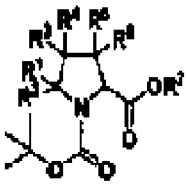
添付公開書類:
— 国際調査報告書

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。

(57) 要約:

下記式（２）で示されるＮ－保護ピロリジノン類に還元剤を反応させて、下記式（３）で示されるＮ－保護ピロリジノール類を製造する工程（Ａ工程)、Ａ工程で得られたＮ－保護ピロリジノール類にシアノ化剤を反応させて、下記式（４）で示されるＮ－保護シアノピロリジン類を製造する工程（Ｂ工程)、Ｂ工程で得られたＮ－保護シアノピロリジン類に、アルコールと塩基を反応させて、下記式（５）で示されるイミデート類を得、該イミデート類を酸で処理して、下記式（６）で示されるＮ－保護プロリン類を製造する工程（Ｃ工程)、Ｃ工程で得られたＮ－保護プロリン類を酸で処理する工程（Ｄ工程）を含む、下記式（１）で示されるプロリン誘導体又はその酸付加塩を製造する方法。


(1)

(2)

(3)

(4)

(5)

(6)

[式中、Ｒ1、Ｒ2、Ｒ3、Ｒ4、Ｒ5及びＲ6のうち任意の２つが結合して、置換基を有していてもよい炭素数１～４のポリメチレン基を形成しており、Ｒ7は置換基を有していてもよい炭素数１～１０の直鎖状アルキル基等を表す。]