

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局(43) 国際公開日
2008 年 7 月 17 日 (17.07.2008)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2008/084671 A1

(51) 国際特許分類:

C07D 213/82 (2006.01) C07D 405/12 (2006.01)
C07D 213/803 (2006.01) C07D 409/12 (2006.01)
C07D 227/087 (2006.01) C07D 417/12 (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2007/074791

(22) 国際出願日: 2007 年 12 月 25 日 (25.12.2007)

(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 2006-351281

2006 年 12 月 27 日 (27.12.2006) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 塩野義製薬株式会社 (SHIONOGI & CO., LTD.) [JP/JP]; 〒5410045 大阪府大阪市中央区道修町 3 丁目 1 番 8 号 Osaka (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 海野 知宏 (UNNO, Tomohiro) [JP/JP]; 〒6600813 兵庫県尼崎市杭瀬寺島 2 丁目 1 番 3 号 塩野義製薬株式会社内 Hyogo (JP). 森田 順一 (MORITA, Junichi) [JP/JP]; 〒6600813 兵庫県尼崎市杭瀬寺島 2 丁目 1 番 3 号 塩野義製薬株式会社内 Hyogo (JP). 篠本 徹次 (SHINOMOTO, Shoji)

[JP/JP]; 〒5530002 大阪府大阪市福島区鷺洲 5 丁目 1 2 番 4 号 塩野義製薬株式会社内 Osaka (JP). 菅田 良英 (SUGATA, Yoshihide) [JP/JP]; 〒5530002 大阪府大阪市福島区鷺洲 5 丁目 1 2 番 4 号 塩野義製薬株式会社内 Osaka (JP). 井出 豊 (IDE, Yutaka) [JP/JP]; 〒5530002 大阪府大阪市福島区鷺洲 5 丁目 1 2 番 4 号 塩野義製薬株式会社内 Osaka (JP).

(74) 代理人: 高山 裕貢, 外(TAKAYAMA, Hirotsugu et al.); 〒5530002 大阪府大阪市福島区鷺洲 5 丁目 1 2 番 4 号 塩野義製薬株式会社 知的財産部 Osaka (JP).

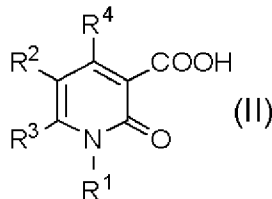
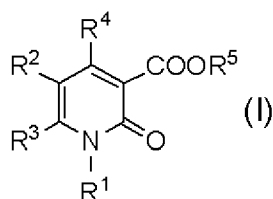
(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, 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, MT, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK,

/ 続葉有 /

(54) Title: PROCESS FOR PRODUCING 1-SUBSTITUTED-2-PYRIDONE-3-CARBOXYLIC ACID DERIVATIVE

(54) 発明の名称: 1-置換-2-ピリドン-3-カルボン酸誘導体の製造方法



the general formula (II), which comprises: a step A for hydrolyzing a compound represented by the general formula (I); and a step (B) for adding an alcohol to the hydrolysate of the compound represented by the general formula (I) produced in the step A to produce a crystal of the compound represented by the general formula (II). (I) wherein R¹ represents an alkyl which may be substituted by a non-reactive substituent, or the like; R² and R³ independently represent an alkyl or the like, or R² and R³, together with a carbon atom adjacent to R² and R³, may form a cycloalkene; R⁴ represents a hydrogen atom or the like; and R⁵ represents an alkyl. (II) wherein R¹, R², R³ and R⁴ are as defined above.

(57) Abstract: Disclosed are: a process for producing a 1-substituted-2-pyridone-3-carboxylic acid derivative which is an important intermediate for the production of a 2-pyridone-3-carbamoyl derivative that has a cannabinoid receptor agonist activity in a simple manner; and a process for producing the 2-pyridone-3-carbamoyl derivative in a simple manner. Specifically disclosed is a process for producing a compound represented by

(57) 要約: カンナビノイド受容体アゴニスト活性を有する2-ピリドン-3-カルバモイル誘導体の重要中間体である1-置換-2-ピリドン-3-カルボン酸誘導体および2-ピリドン-3-カルバモイル誘導体の簡便な製造方法を提供する。一般式(I): (式中、R¹は非反応性置換基で置換されていてもよいアルキル等; R²及びR³はそれぞれ独立して、アルキル等; 又はR²及びR³は隣接する炭素原子と一緒に、シクロアルケンを形成してもよい; R⁴は水素原子等; R⁵はアルキル)で示される化合物を加水分解する工程A、及び、工程Aで生成した一般式(I)で示される化合物の加水分解物にアルコールを添加し、一般式(II): (式中、R¹、R²、R³、及びR⁴は上記と同意義)で示される化合物の結晶を生成させる工程Bを含む、一般式(II)で示される化合物の製造方法。



WO 2008/084671 A1



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