

【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 19 年 6 月 7 日 (2007.6.7)

【公表番号】特表 2003-528828 (P2003-528828A)

【公表日】平成 15 年 9 月 30 日 (2003.9.30)

【出願番号】特願 2001-563480 (P2001-563480)

【国際特許分類】

**C 0 7 D 207/27 (2006.01)**

A 6 1 K 31/4015 (2006.01)

A 6 1 P 25/08 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

C 0 7 B 61/00 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 207/27

A 6 1 K 31/4015

A 6 1 P 25/08

A 6 1 P 25/28

C 0 7 B 61/00 3 0 0

C 0 7 M 7:00

【手続補正書】

【提出日】平成 19 年 4 月 10 日 (2007.4.10)

【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

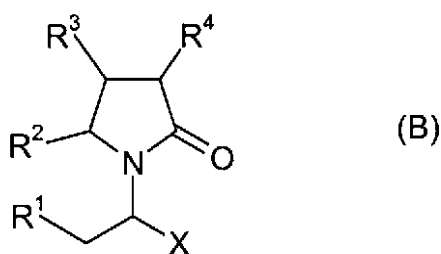
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】 一般式 (B)

【化 1】



(上記式中、

Xは-CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>、または-COOR<sup>7</sup>、または-COR<sup>8</sup>、またはCNであり、

R<sup>1</sup>は水素、ハロゲンまたはアルキルであり、

R<sup>2</sup>及びR<sup>4</sup>は同一であるかまたは異なっており、それぞれ独立して水素、ハロゲンまたはアルキルであり、

R<sup>3</sup>は水素、ハロゲン、アルキルまたは(C2-C5)アルケニルであり、

R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup>は同一であるかまたは異なっており、それぞれ独立して水素またはアルキルであり、

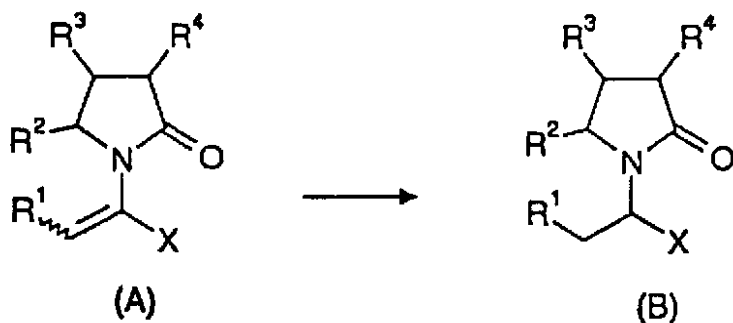
R<sup>8</sup>は、水素、ヒドロキシまたはアルキルであり、

各アルキルは1～20個の炭素原子を含み、直鎖、分枝鎖、若しくは環状残基、又はそ

の組合せを有し、必要に応じて、ハロゲン、ヒドロキシ、チオール、アミノ、ニトロ、シアノ、アシル、アシルオキシ、 $-SO_2$ -アルキル、 $-SO_2$ -アリール、 $-SO$ -アルキル、 $-SO$ -アリール、アルキルアミノ、カルボキシ、エステル、エーテル、アミド、スルホン酸、スルホンアミド、アルコシカルボニル、アルキルチオ、アリールチオ、オキシエステル、オキシアミド、ヘテロシクロアルキル、ヘテロアリール、ビニル、(C1-C5)アルコキシ、(C6-C10)アリールオキシ、(C6-C10)アリールからなる群から独立に選ばれる1～5個の置換基により置換されていてもよい)

を有する化合物の調製方法であって、下記の工程図(6)

【化2】



工程図(6)

に従って、一般式(A)の化合物(上記式、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ およびXは上記と同じ意味を有する)を反応させることを含んでなる、上記方法。

【請求項2】 式(A)の化合物の接触水素化を含んでなる、請求項1に記載の方法。

【請求項3】 式(A)の化合物にキラル触媒を用いる不斉水素化を行う、請求項1に記載の方法。

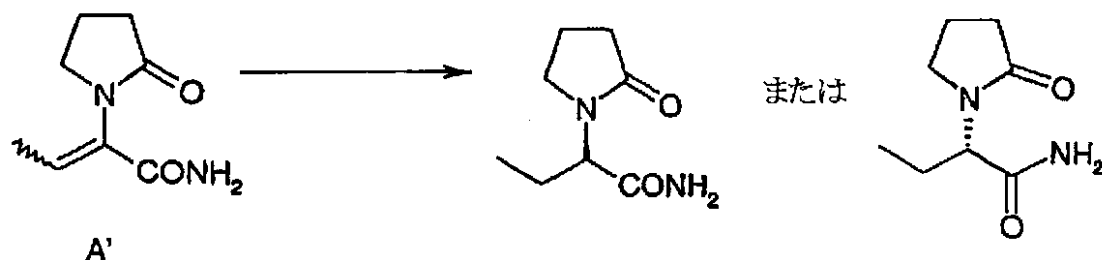
【請求項4】  $R^1$ がメチルであり、 $R^2$ および $R^4$ が水素であり、 $R^3$ が水素、アルキルまたは1つ以上のハロゲンで置換された(C2-C5)アルケニルであり、Xが $-CONH_2$ または $-COOMe$ または $-COOEt$ または $-COOH$ である、請求項1に記載の方法。

【請求項5】  $R^3$ が水素、 $n$ -プロピルまたは2,2-ジフルオロビニルである、請求項4に記載の方法。

【請求項6】 式(A)の化合物がZ異性体またはE異性体である、請求項1に記載の方法。

【請求項7】 (S)- -エチル-2-オキソ-1-ピロリジンアセタミドまたは(R)- -エチル-2-オキソ-1-ピロリジンアセタミドの調製のための請求項1に記載の方法であって、下記の工程図

【化3】



に従って、Z異性体またはE異性体の形態の式A'の化合物にキラル触媒を用いる不斉水素化を行うことを含んでなる、上記方法。