

【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 18 年 1 月 12 日 (2006.1.12)

【公開番号】特開 2003-192651 (P2003-192651A)

【公開日】平成 15 年 7 月 9 日 (2003.7.9)

【出願番号】特願 2002-354747 (P2002-354747)

【国際特許分類】

C 07 C 227/32 (2006.01)

C 07 C 229/08 (2006.01)

C 07 C 229/34 (2006.01)

C 07 B 53/00 (2006.01)

C 07 B 61/00 (2006.01)

【F I】

C 07 C 227/32

C 07 C 229/08

C 07 C 229/34

C 07 B 53/00 C

C 07 B 61/00 3 0 0

C 07 M 7:00

【手続補正書】

【提出日】平成 17 年 11 月 22 日 (2005.11.22)

【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

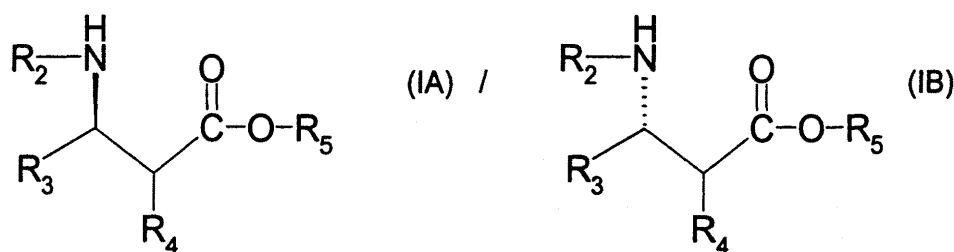
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】 遊離塩基またはその酸付加塩としての式 I A または I B :

【化 1】



〔式中、R₂は水素、置換されていないまたは置換されたアルキル、または置換されていないまたは置換されたアリールであり、

R₃は、各場合、置換されていないかまたは置換された、アルキル、アリールまたは複素環であるか、あるいはエステル化されたカルボキシルまたはカルボキシルであり、

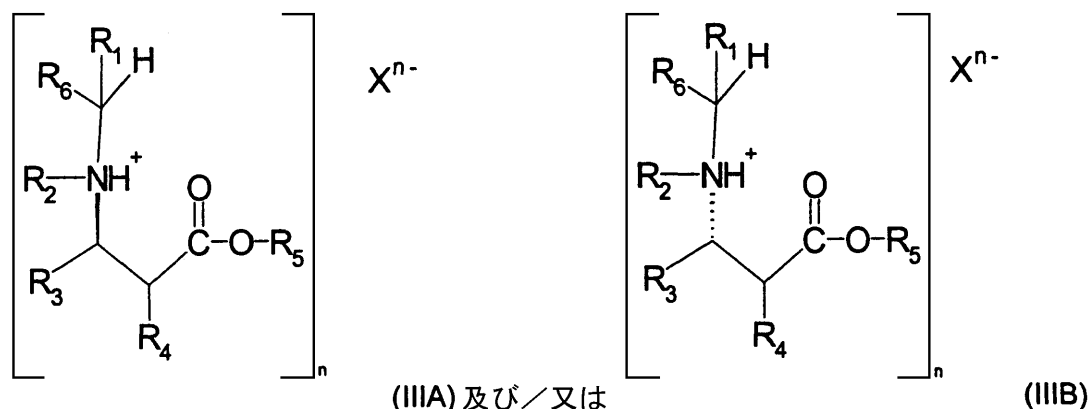
R₄は水素、置換されていないまたは置換されたアルキル、モノ - またはジ置換アミノ、ヒドロキシル、置換されていないまたは置換されたアルコキシまたは置換されていないまたは置換されたアリールオキシであり、

あるいはR₃およびR₄は、それらに結合する炭素原子と一緒に5 - または6 - 員環を形成し、および

R₅は水素、置換されていないまたは置換されたアルキル、置換されていないまたは置

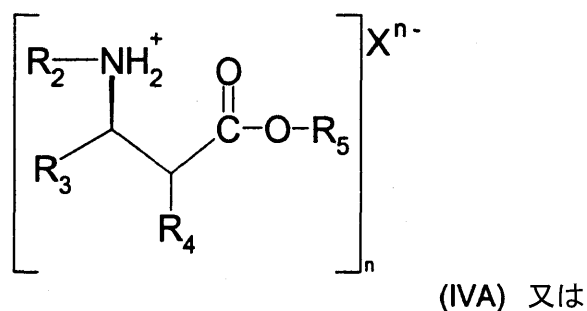
換されたアリールまたは有機シリルである〕
 の光学的に活性な化合物の製法であって、
 式 IIIA および / または IIIB :

【化 2】

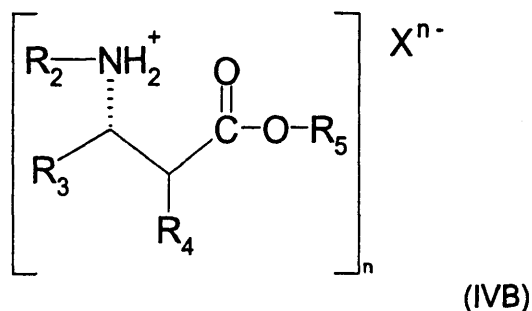


〔式中、 n は 1 を超えるかまたはそれに等しい整数、特に 1 ~ 3 であり、 X^{n-} は酸アニオンであり、 R_1 および R_6 は、各場合、置換されていないかまたは置換された、アルキル、アリールまたは複素環であり、但し、 R_1 は R_6 以外の基であり、2 つの基のうち少なくとも 1 つは置換されていないまたは置換されたアリールあるいは置換されていないまたは置換された複素環、特に、アリールであり、 R_2 、 R_3 、 R_4 および R_5 は式 I A および I B の化合物について定義した通りである〕の酸付加塩を、キラル補助基 $\text{R}_1\text{R}_6\text{CH-}$ の除去によって、式 IVA および / または (好ましくはまたは) IVB :

【化 3】



【化 4】



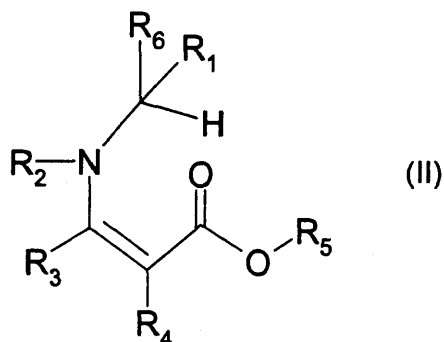
〔式中、 n および基 R_2 ないし R_5 は式 I A または I B の化合物で定義した通りであり、 X^{n-} は酸アニオンである〕

の対応する塩に変換し、所望により、得られた式 IVA または IVB の酸付加塩を、塩基の存

在下で、式 I A または I B の遊離化合物に変換し；および / または、所望により、もし R_5 が水素以外の前記した意味のもう 1 つを有するならば、基 R_5 を式 I V A または I V B のエステルから除去する方法。

【請求項 2】 式 II：

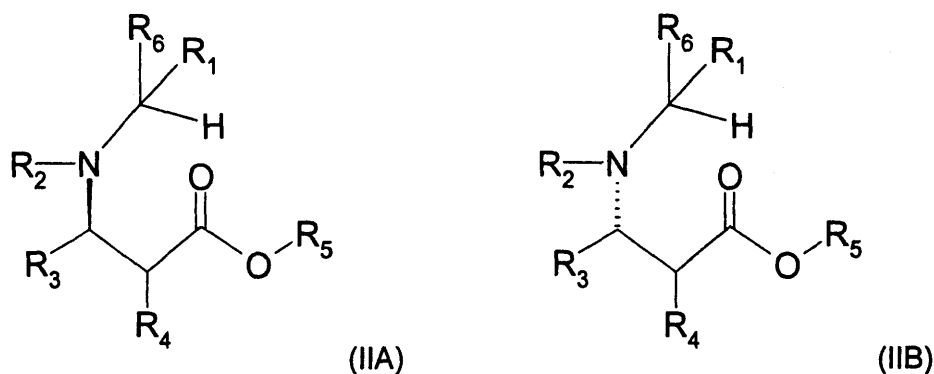
【化 5】



〔式中、 R_1 および R_6 は、各場合、置換されていないかまたは置換された、アルキル、アリールまたは複素環であり、但し、 R_1 は R_6 以外の基であり、2 つの基のうち少なくとも 1 つは置換されていないかまたは置換されたアリール、または置換されていないかまたは置換された複素環、好ましくはアリールであり、

R_2 、 R_3 、 R_4 および R_5 は式 I A または I B の化合物で定義した通りである〕
 の化合物を、触媒活性量の不均一水素化触媒の存在下で二重結合の飽和で水素化して、式 I I A および / または I I B

【化 6】



〔式中、基 R_1 および R_6 は式 II の化合物で定義した通りであり、基 R_2 、 R_3 、 R_4 および R_5 は式 I A および I B の化合物について定義した通りである〕

の化合物を得、次いで、得られた生成物を式 $[H^+]_n X^{n-}$ (式中、 n は 1 ~ 3 であって、 X は酸基である) の酸で請求項 1 に示された式 I I I A または I I I B：

〔式中、 n は 1 より大きいかまたはそれに等しく、特に、1 ~ 3 であり、基 R_1 ないし R_6 は式 II の化合物で定義した通りであり、および X^{n-} は無機酸アニオンである〕

の対応する酸付加塩に変換し、得られた塩を結晶化し；

次いで、キラル補助基 $R_1 R_6 C H -$ を除去し、かくして、請求項 1 に示された式 I V A または I V B の対応する塩を得、

ここに、 n および基 R_2 ないし R_5 は式 I A または I B の化合物について定義した通りであり、 X^{n-} は酸アニオンであり、

所望により、得られた式 I V A または I V B の酸付加塩を塩基の存在下で式 I A または I B の遊離化合物に変換し、および / または所望により、 R_5 が水素以外を意味する場合、基 R_5 を得られた式 I A または I B の化合物から除去する、

遊離塩基としての、またはその酸付加塩としての請求項 1 に示された式 I A または I B
〔式中、 R_2 は水素、置換されていないまたは置換されたアルキル、または置換されてい
ないまたは置換されたアリールであり、

R_3 は、各場合、置換されていないかまたは置換された、アルキル、アリールまたは複
素環であるか、あるいはエステル化されたカルボキシルまたはカルボキシルであり、

R_4 は水素、置換されていないかまたは置換されたアルキル、モノ - またはジ置換アミ
ノ、ヒドロキシル、置換されていないかまたは置換されたアルコキシ、または置換されて
いないかまたは置換されたアリールオキシであり、

あるいは R_3 および R_4 はそれらに結合する炭素原子と一緒にあって 5 - または 6 - 員環
を形成し、および

R_5 は水素、置換されていないまたは置換されたアルキルまたは有機シリルである〕
の光学的に活性な化合物を製造するための請求項 1 記載の製法。

【請求項 3】 請求項 1 又は 2 記載の製法を含む、生物学的に活性な化合物の製法。