

(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
2011 年 12 月 8 日(08.12.2011)

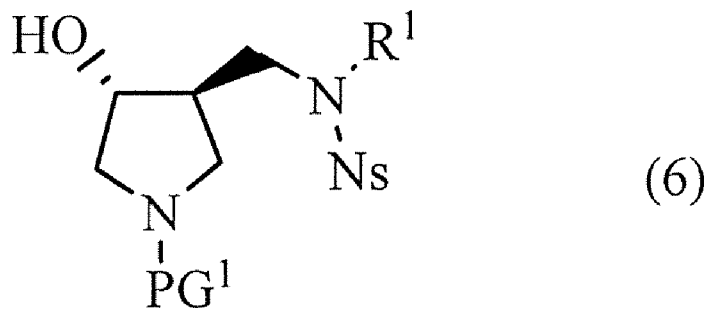
PCT

(10) 国際公開番号
WO 2011/152354 A1

- (51) 国際特許分類:
C07D 207/10 (2006.01) C07B 61/00 (2006.01)
- (21) 国際出願番号: PCT/JP2011/062385
- (22) 国際出願日: 2011 年 5 月 30 日(30.05.2011)
- (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 2010-123889 2010 年 5 月 31 日(31.05.2010) JP
- (71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 杏林製薬株式会社 (KYORIN PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒1018311 東京都千代田区神田駿河台 2 丁目 5 番地 Tokyo (JP).
- (72) 発明者; および
- (75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 鈴木 雅士 (SUZUKI Masashi), 長尾 宗樹 (NAGAO Muneki).
- (74) 代理人: 小栗 昌平, 外 (OGURI Shohei et al.); 〒1050003 東京都港区西新橋一丁目 7 番 1 3 号 虎ノ門イーストビルディング 10 階 栄光特許事務所 Tokyo (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, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, 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, PE, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, 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, LR, 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 (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, 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 (条約第 21 条(3))

(54) Title: PROCESS FOR PREPARATION OF 3-SUBSTITUTED-4-FLUOROPYRROLIDINE DERIVATIVES

(54) 発明の名称: 3-置換-4-フルオロピロリジン誘導体の製造方法



(57) Abstract: Provided is a process for preparing, with industrial advantages and at a low cost, optically active syn-3-(N-substituted-aminomethyl)-4-fluoropyrrolidines which can serve as intermediates in the preparation of drugs. More specifically disclosed is a process for the preparation of syn-1-protected-4-fluoro-3-(N-substituted-N-nitrobenzenesulfonyl)pyrrolidine derivatives, enantiomers thereof, or salts of the same, which includes a step of fluorinating a compound represented by general formula (6) or an enantiomer thereof with both a nucleophilic fluorinating agent and an organic base having an amidine or guanidine structure. In general formula (6), PG¹ is an amino-protecting group; R¹ is optionally substituted C₁₋₆ alkyl or optionally substituted C₃₋₈ cycloalkyl; and Ns is a 2-nitrobenzenesulfonyl group or a 4-nitrobenzenesulfonyl group.

(57) 要約: 医薬品の製造中間体となりうる syn-3-(N-置換-アミノメチル)-4-フルオロピロリジン光学活性体の安価で工業的に有利な製造方法を提供する。本発明は、一般式 (6) (式中、PG¹ はアミノ基の保護基を示し、R¹ は置換されていてもよい C₁~C₆ のアルキル基または置換されていてもよい C₃~C₈ のシクロアルキル基を表し、Ns は 2-ニトロベンゼンスルホニル基または 4-ニトロベンゼンスルホニル基を表す。) で表される化合物またはその鏡像異性体を、求核的なフッ素化剤と、アミジンまたはグアニジン構造を有する有機塩基とを用いてフッ素化する工程を含む、syn-1-保護-4-フルオロ-3-(N-置換-N-ニトロベンゼンスルホニル)ピロリジン誘導体若しくはその鏡像異性体、またはそれらの塩を製造する方法に関する。

WO 2011/152354 A1