

(12) DEMANDE INTERNATIONALE PUBLIÉE EN VERTU DU TRAITÉ DE COOPÉRATION EN MATIÈRE DE BREVETS (PCT)

(19) Organisation Mondiale de la Propriété
Intellectuelle
Bureau international



(10) Numéro de publication internationale
WO 2011/042478 A1

(43) Date de la publication internationale
14 avril 2011 (14.04.2011)

(51) Classification internationale des brevets :
C07D 233/84 (2006.01)

(21) Numéro de la demande internationale :
PCT/EP2010/064947

(22) Date de dépôt international :
6 octobre 2010 (06.10.2010)

(25) Langue de dépôt : français

(26) Langue de publication : français

(30) Données relatives à la priorité :
0956968 6 octobre 2009 (06.10.2009) FR

(71) Déposant (pour tous les États désignés sauf US) :
TETRAHEDRON [FR/FR]; 4bis, allée Charles V,
F-94300 Vincennes (FR).

(72) Inventeurs; et

(75) Inventeurs/Déposants (pour US seulement) :
ERDELMEIER, Irène [DE/FR]; 81, rue Bobillot,
F-75013 Paris (FR). DAUNAY, Sylvain [FR/FR]; 43, rue
du port, F-94130 Nogent sur Marne (FR).

(74) Mandataire : WARCOIN, Jacques; Cabinet Regimbeau,
20, rue de Chazelles, F-75847 Paris Cedex 17 (FR).

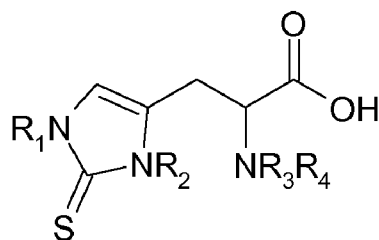
(81) États désignés (sauf indication contraire, pour tout titre
de protection nationale disponible) : AE, AG, AL, AM,
AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ,
CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO,
DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT,
HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, 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) États désignés (sauf indication contraire, pour tout titre
de protection régionale disponible) : ARIPO (BW, GH,
GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG,
ZM, ZW), eurasién (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ,
TM), européen (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).

[Suite sur la page suivante]

(54) Title : METHOD FOR THE SYNTHESIS OF 2-THIOHISTIDINE AND THE LIKE

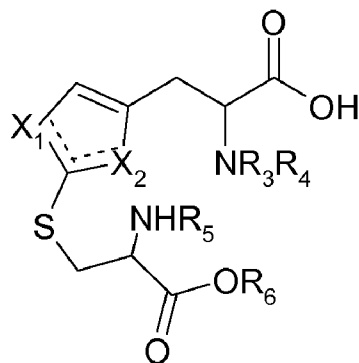
(54) Titre : PROCEDE DE SYNTHÈSE DE LA 2-THIOHISTIDINE ET ANALOGUES



(I)

(57) Abstract : The invention relates to a method for the synthesis of 2-thiohistidine or a derivative thereof of the formula (I), or of a physiologically acceptable salt, a tautomer, a stereoisomer or a mixture of stereoisomers in any proportions thereof, from a compound of the formula (II) or a physiologically acceptable salt, a tautomer, a stereoisomer or a mixture of stereoisomers in any proportions thereof, by cleavage reaction in the presence of a thiol at a temperature higher than or equal to 60°C. The invention also relates to compounds of the formula (II) and a method for the synthesis thereof.

(57) Abrégé : La présente invention concerne un procédé de synthèse de 2-thiohistidine ou de l'un de ses dérivés de formule (I), ou d'un sel physiologiquement acceptable, d'un tautomère, d'un stéréoisomère ou d'un mélange de stéréoisomères en toutes proportions de celui-ci, à partir d'un composé de formule (II), ou d'un sel physiologiquement acceptable, d'un tautomère, d'un stéréoisomère ou d'un mélange de stéréoisomères en toutes proportions de celui-ci, par réaction de clivage en présence d'un thiol, à une température supérieure ou égale à 60°C. La présente invention concerne également les composés de formule (II) et leur procédé de synthèse.



(II)



Déclarations en vertu de la règle 4.17 :

— *relative à la qualité d'inventeur (règle 4.17.iv)*

Publiée :

— *avec rapport de recherche internationale (Art. 21(3))*