

(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 7 月 14 日(14.07.2011)

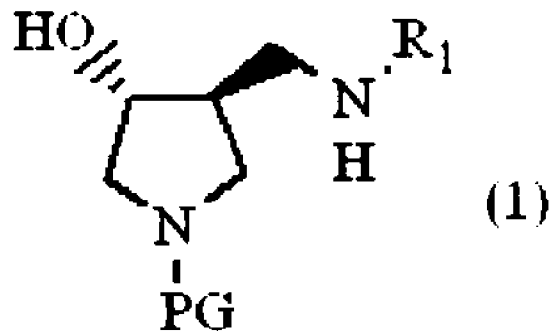
(10) 国際公開番号
WO 2011/083858 A1

- (51) 国際特許分類:
C07D 207/10 (2006.01)
- (21) 国際出願番号: PCT/JP2011/050206
- (22) 国際出願日: 2011 年 1 月 7 日(07.01.2011)
- (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 2010-002665 2010 年 1 月 8 日(08.01.2010) 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): 荒谷 一郎 (ARAYA Ichirou). 織田 和雄 (ORITA Kazuo).
- (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
- (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).

[続葉有]

(54) Title: METHOD FOR PRODUCING 3,4-DISUBSTITUTED PYRROLIDINE DERIVATIVE AND PRODUCTION INTERMEDIATE THEREOF

(54) 発明の名称: 3, 4-ジ置換ピロリジン誘導体の製造方法及び製造中間体



(57) Abstract: Disclosed is an economical and industrially advantageous method for producing a (3R,4S)-3-(N-substituted-aminomethyl)-4-fluoropyrrolidine, which is usable as an intermediate in producing a medicine, or an enantiomer thereof. Specifically disclosed is a method for producing a (3R,4S)-3-(N-substituted-cyclopropylaminomethyl)-4-fluoropyrrolidine derivative, an enantiomer thereof or a salt of the same, comprising a step for fluorinating a 4-hydroxy-3-(N-substituted-aminomethyl)pyrrolidine derivative represented by general formula (1) or an enantiomer thereof by using a sulfur tetrafluoride derivative. In general formula (1), PG represents a protecting group for the amino group; and R₁ represents an optionally substituted C₁₋₆ alkyl group or an optionally substituted C₃₋₈ cycloalkyl group.

(57) 要約: 医薬品の製造中間体となりうる (3R, 4S) - 3 - (N - 置換 - アミノメチル) - 4 - フルオロピロリジン又はその鏡像異性体の安価で工業的に有利な製造方法を提供する。一般式 (1) で示される 4 - ヒドロキシ - 3 - (N - 置換 - アミノメチル) ピロリジン誘導体又はその鏡像異性体を、四フッ化硫黄誘導体を用いてフッ素化する工程を含む、(3R, 4S) - 3 - (N - 置換 - シクロプロピルアミノメチル) - 4 - フルオロ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。[式 (1) 中、PG 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す。]



WO 2011/083858 A1