

(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
2014 年 5 月 8 日(08.05.2014)



(10) 国際公開番号

WO 2014/069351 A1

- (51) 国際特許分類:
C07D 211/60 (2006.01) C07B 53/00 (2006.01)
C07D 471/08 (2006.01) C07B 61/00 (2006.01)
C07D 487/08 (2006.01)
- (21) 国際出願番号: PCT/JP2013/078918
- (22) 国際出願日: 2013 年 10 月 25 日(25.10.2013)
- (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 2012-242227 2012 年 11 月 1 日(01.11.2012) JP
特願 2013-014760 2013 年 1 月 29 日(29.01.2013) JP
- (71) 出願人: 株式会社カネカ(KANEKA CORPORATION) [JP/JP]; 〒5308288 大阪府大阪市北区中之島二丁目 3 番 1 8 号 Osaka (JP).
- (72) 発明者: 平井 義則(HIRAI, Yoshinori); 〒6768688 兵庫県高砂市高砂町宮前町 1-8 株式会社カネカ内 Hyogo (JP). 西山 章(NISHIYAMA, Akira); 〒6768688 兵庫県高砂市高砂町宮前町 1-8 株式会社カネカ内 Hyogo (JP).
- (74) 代理人: 植木 久一, 外(UETKI, Kyuichi et al.); 〒5300003 大阪府大阪市北区堂島 2 丁目 1 番 1 6 号 フジタ東洋紡ビル 9 階 Osaka (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, BN, 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, IR, IS, JP, KE, KG, 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, PA, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SA, 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, RW, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーロパ (AM, AZ, BY, KG, KZ, 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, KM, 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: METHOD FOR PRODUCING OPTICALLY ACTIVE BICYCLIC UREA COMPOUND

(54) 発明の名称: 光学活性二環式ウレア化合物の製造方法

(57) Abstract: The objective of the present invention is to provide a method for simply and efficiently producing an optically active bicyclic urea compound that is useful as an intermediate for a β -lactamase inhibitor. According to the present invention, a given ester compound and an amine are reacted with each other in the presence of a metal alkoxide and/or an alkaline earth metal salt, thereby producing a corresponding amide compound. After that, the amide compound is reacted with phosgene or a phosgene equivalent and, if necessary, treated with an acid or a base, thereby producing an optically active bicyclic urea compound. Consequently, an optically active bicyclic urea compound can be simply and efficiently produced with high optical purity without using expensive catalyst, condensation agent and the like, and without requiring protection and deprotection steps.

(57) 要約: 本発明の課題は、 β -ラクタマーゼ阻害剤中間体として有用な光学活性二環式ウレア化合物を簡便且つ効率よく製造する方法を提供する点にある。本発明では、金属アルコキシド及び／又はアルカリ土類金属塩の存在下、所定のエステル化合物とアミンを反応させることにより、対応するアミド化合物を製造する。続いて、これをホスゲン、又はホスゲン等価体と反応させ、必要に応じて酸、又は塩基で処理することにより、光学活性二環式ウレア化合物を製造する。これにより、高価な触媒や縮合剤などを使用することなく、また、保護や脱保護工程を経ることなく、光学活性二環式ウレア化合物を簡便且つ効率よく、高光学純度で製造することができる。

WO 2014/069351 A1