

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局



(43) 国際公開日
2004 年 9 月 10 日 (10.09.2004)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2004/076404 A1

(51) 国際特許分類⁷: C07C 319/14, 51/43, 57/58, 319/28, 323/56 // C07B 53/00, 55/00, C07M 7:00

(74) 共通の代表者: 鐘淵化学工業株式会社 (KANEKA CORPORATION); 〒5308288 大阪府大阪市北区中之島 3 丁目 2 番 4 号 Osaka (JP).

(21) 国際出願番号: PCT/JP2004/002231

(22) 国際出願日: 2004 年 2 月 25 日 (25.02.2004)

(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 2003-054265 2003 年 2 月 28 日 (28.02.2003) 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, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 鐘淵化学工業株式会社 (KANEKA CORPORATION) [JP/JP]; 〒5308288 大阪府大阪市北区中之島 3 丁目 2 番 4 号 Osaka (JP).

(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, LS, MW, MZ, 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 (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 山本 祥吾 (YAMAMOTO, Shogo) [JP/JP]; 〒6550872 兵庫県神戸市垂水区塩屋町 6 丁目 3 1 - 1 7 三青荘 Hyogo (JP). 武田 俊弘 (TAKEDA, Toshihiro) [JP/JP]; 〒6760075 兵庫県高砂市伊保崎南 1 1 - 7 Hyogo (JP). 布施 佳秀 (FUSE, Yoshihide) [JP/JP]; 〒6512243 兵庫県神戸市西区井吹台西町 4 - 2 6 - 1 3 Hyogo (JP). 上田 恭義 (UEDA, Yasuyoshi) [JP/JP]; 〒6711227 兵庫県姫路市網干区和久 1 4 0 - 1 5 Hyogo (JP).

添付公開書類:
— 国際調査報告書

2 文字コード及び他の略語については、定期発行される各 PCT ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: PROCESSES FOR THE PRODUCTION OF OPTICALLY ACTIVE COMPOUNDS HAVING SUBSTITUENTS AT THE 2-POSITION

(54) 発明の名称: 2 位に置換基を有する光学活性化合物の製造法

(57) Abstract: Optically active compounds having thio groups at the 2-position which are important to the production of drugs and so on can be produced with minimized racemization in high yield and at a low cost by chlorinating an optically active compound having a hydroxyl group at the 2-position with the inversion of configuration at the 2-position to form an optically active compound having a chlorine atom at the 2-position, and reacting the optically active compound having a chlorine atom at the 2-position with a metal thiolate to introduce a thio group to the compound with the inversion of configuration at the 2-position. Further, optically active compounds having thio groups at the 2-position can be produced at higher optical purities and in higher yields by conducting the reaction of an optically active compound having a chlorine atom at the 2-position with a metal thiolate in the presence of water. Additionally, optically active carboxylic acids having thio groups at the 2-position can be efficiently rid of coexistent impurities such as optical isomers by crystallization in the presence of an aliphatic hydrocarbon solvent and/or a sulfur-containing solvent, whereby optically active carboxylic acids having thio groups at the 2-position can be obtained as crystalline substances at further enhanced purities.

(57) 要約: 医薬品等の製造上重要な 2 位にチオ基を有する光学活性化合物の製造法を提供する。2 位にヒドロキシ基を有する光学活性化合物を、2 位の立体配置の反転を伴って塩素化し、得られた 2 位に塩素原子を有する光学活性化合物を、チオ金属塩と反応させて、2 位の立体配置の反転を伴ってチオ基を導入することにより、ラセミ化を最小化し、高収率で安価に 2 位にチオ基を有する光学活性化合物を製造できる。また、2 位に塩素原子を有する光学活性化合物をチオ金属塩と反応させる際に、反応系中に水を共存させることにより、さらに光学純度を高め、より高収率で 2 位にチオ基を有する光学活性化合物を製造できる。2 位にチオ基を有する光学活性カルボン酸は、脂肪族炭化水素系溶剤及び／又は含硫黄系溶剤下で晶析することにより、光学異性体等の共存不純物を効率的に除去し、さらに純度が向上した 2 位にチオ基を有する光学活性カルボン酸を結晶として取得することができる。

WO 2004/076404 A1