

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局



(43) 国際公開日
2005 年 1 月 27 日 (27.01.2005)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2005/007638 A1

(51) 国際特許分類⁷: C07D 301/24, 303/14, 249/08,
309/12, 405/06, C07C 33/46, 29/10, 43/178, 41/26, 69/28,
67/29, C07F 7/08, C07B 53/00

砂市高砂町宮前町 1 - 8 鐘淵化学工業株式会社内
Hyogo (JP).

(21) 国際出願番号: PCT/JP2004/009883

(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 - 4 Osaka (JP).

(22) 国際出願日: 2004 年 7 月 5 日 (05.07.2004)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(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.

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願2003-199447 2003 年 7 月 18 日 (18.07.2003) JP
特願2004-042437 2004 年 2 月 19 日 (19.02.2004) JP

(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 - 4 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, 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 (AT, BE, BG,
CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE,
IT, LU, MC, NL, PL, 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): 大黒 一美
(OKURO, Kazumi) [JP/JP]; 〒6768688 兵庫県高砂
市高砂町宮前町 1 - 8 鐘淵化学工業株式会社内
Hyogo (JP). 田中 辰佳 (TANAKA, Tatsuyoshi) [JP/JP];
〒6768688 兵庫県高砂市高砂町宮前町 1 - 8 鐘淵
化学工業株式会社内 Hyogo (JP). 満田 勝 (MITSUDA,
Masaru) [JP/JP]; 〒6768688 兵庫県高砂市高砂町宮
前町 1 - 8 鐘淵化学工業株式会社内 Hyogo (JP). 井
上 健二 (INOUE, Kenji) [JP/JP]; 〒6768688 兵庫県高

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: OPTICALLY ACTIVE HALOHYDRIN DERIVATIVE AND PROCESS FOR PRODUCING OPTICALLY ACTIVE
EPOXY ALCOHOL DERIVATIVE FROM THE SAME

(54) 発明の名称: 光学活性ハロヒドリン誘導体およびそれを用いた光学活性エポキシアルコール誘導体の製造法

(57) Abstract: A process by which an optically active epoxy alcohol derivative useful as an intermediate for medicines can be easily
and industrially safely produced from an inexpensively available material; and a halohydrin derivative which is an important novel
intermediate therefor. Also provided is a process for producing an intermediate for triazole type antifungal agents through a small
number of steps, which comprises reacting the halohydrin derivative with a triazolesulfonamide. An optically active, substituted
propionic ester derivative is reacted with a haloacetic acid derivative in the presence of a base to obtain an optically active haloke-
tone derivative and this derivative is reacted with an arylmetal compound to stereoselectively obtain a halohydrin derivative. This
halohydrin derivative is subjected to elimination of the substituent present on the hydroxy group and to epoxidation with a base to
produce an optically active epoxy alcohol derivative.

[続葉有]



WO 2005/007638 A1



(57) 要約:

医薬品中間体として有用な光学活性エポキシアルコール誘導体を、安価で入手可能な原料から、簡便かつ工業的に安全に実施可能な方法、ならびにそれらの重要新規中間体化合物ハロヒドリン誘導体を提供する。また、ハロヒドリンをトリアゾールのスルホンアミド体と反応させることにより短工程でトリアゾール系抗真菌剤中間体を製造するプロセスを提供する。光学活性置換プロピオン酸エステル誘導体を塩基存在下、ハロ酢酸誘導体と反応させることにより、光学活性ハロケトン誘導体とし、次いでアリール金属化合物と反応させて立体選択的に得られるハロヒドリン誘導体を水酸基上置換基の脱離、塩基によるエポキシ化により光学活性なエポキシアルコール誘導体を製造する。また、ハロヒドリン誘導体をトリアゾールのスルホンアミド体と反応させることにより短工程でトリアゾール系抗真菌剤中間体を製造する。