

9805093-5  
1905世界知的所有権機関  
国際事務局

PCT

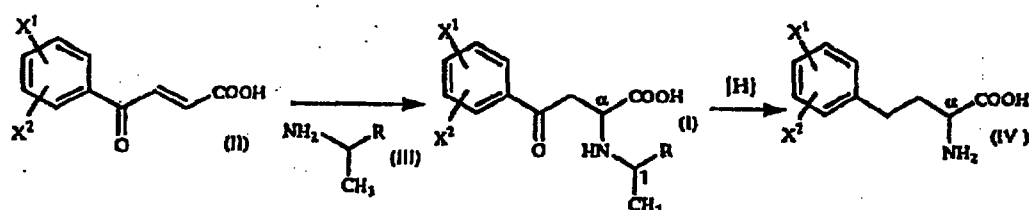
特許協力条約に基づいて公開された国際出願

|                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                            |           |                                                                                                                                                                                                                                                                             |
|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| <b>(51) 国際特許分類6</b><br>C07C 229/36, 227/08                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                 | <b>A1</b> | <b>(11) 国際公開番号</b><br>WO98/35934<br><b>(43) 国際公開日</b><br>1998年8月20日(20.08.98)                                                                                                                                                                                               |
| <b>(21) 国際出願番号</b><br>PCT/JP98/00580<br><b>(22) 国際出願日</b><br>1998年2月13日(13.02.98)<br><b>(30) 優先権データ</b><br>特願平9/47399 1997年2月14日(14.02.97) JP<br>特願平9/368161 1997年12月18日(18.12.97) JP<br><b>(71) 出願人 (米国を除くすべての指定国について)</b><br>鐘淵化学工業株式会社(KANEKA CORPORATION)[JP/JP]<br>〒530-8288 大阪府大阪市北区中之島三丁目2番4号<br>Osaka, (JP)<br><b>(72) 発明者 ; および</b><br><b>(75) 発明者 / 出願人 (米国についてのみ)</b><br>山田正彦(YAMADA, Masahiko)[JP/JP]<br>〒651-2102 兵庫県神戸市西区学園東町1-2-110 Hyogo, (JP)<br>長嶋伸夫(NAGASHIMA, Nobuo)[JP/JP]<br>〒676-0025 兵庫県高砂市西畑1丁目13番1-302 Hyogo, (JP)<br>長谷川淳三(HASEGAWA, Junzo)[JP/JP]<br>〒674-0057 兵庫県明石市大久保町高丘2丁目13-4 Hyogo, (JP)                                                                                                                                                                                 |           | <b>(74) 代理人</b><br>弁理士 安富康男, 外(YASUTOMI, Yasuo et al.)<br>〒532-0011 大阪府大阪市淀川区西中島5丁目14番22号<br>リクルート新大阪ビル4階 Osaka, (JP)<br><b>(81) 指定国</b> CN, IL, KR, <u>SG</u> , US, 欧州特許 (AT, BE, CH, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IR, IT, LU, MC, NL, PT, SE).<br><b>添付公開書類</b><br>国際調査報告書 |
| <b>(54) Title:</b> $\gamma$ -OXO-HOMOPHENYLALANINE DERIVATIVES AND PROCESS FOR PRODUCING HOMOPHENYLALANINE DERIVATIVES BY REDUCING THE SAME<br><b>(54)発明の名称</b> $\gamma$ -オキソ-ホモフェニルアラニン誘導体及びそれを還元してなるホモフェニルアラニン誘導体の製造方法<br><div data-bbox="223 1366 1292 1590"></div> <b>(57) Abstract</b><br>A highly economical and efficient process for producing optically active homophenylalanine derivatives represented by general formula (IV); and intermediates therefor and a process for producing the same. The process comprises reacting a $\beta$ -benzoylacrylic acid derivative represented by general formula (II) with a 1-arylethylamine derivative represented by general formula (III) and reducing the resultant $\gamma$ -oxo-homophenylalanine derivative represented by general formula (I). |           |                                                                                                                                                                                                                                                                             |

(57) 要約

本発明は、経済的に優れかつ効率的な下記一般式 (I V) で表される光学活性ホモフェニルアラニン誘導体の製造方法、並びに、その中間体及びその製造方法を提供する。

本発明は、下記一般式 (I I) で表される  $\beta$ -ベンゾイルアクリル酸誘導体と、下記一般式 (I I I) で表される 1-アリアルエチルアミン誘導体とを反応させてなる下記一般式 (I) で表される  $\gamma$ -オキソ-ホモフェニルアラニン誘導体を還元反応に供する下記一般式 (I V) で表されるホモフェニルアラニン誘導体の製造方法である。



PCTに基づいて公開される国際出願のパンフレット第一頁に掲載されたPCT加盟国を同定するために使用されるコード (参考情報)

|    |              |    |           |    |          |    |            |
|----|--------------|----|-----------|----|----------|----|------------|
| AL | アルバニア        | FI | フィンランド    | LT | リトアニア    | SN | セネガル       |
| AM | アルメニア        | FR | フランス      | LV | ラトヴィア    | SZ | スワジランド     |
| AT | オーストリア       | GB | 英国        | MC | モナコ      | TD | チャド        |
| AU | オーストラリア      | GE | グルジア      | MD | モルドヴァ    | TG | トーゴ        |
| AZ | アゼルバイジャン     | GH | ガナ        | MG | マダガスカル   | TJ | タジキスタン     |
| BB | ボスニア・ヘルツェゴビナ | GM | ガンビア      | MK | マケドニア共和国 | TM | トルクメニスタン   |
| BA | バルバドス        | GN | ギニア       |    |          | TR | トルコ        |
| BE | ベルギー         | GW | ギニア・ビサウ   | ML | マリ       | TT | トリニダード・トバゴ |
| BG | ブルガリア        | GU | グアム       | MN | モンゴル     | UA | ウクライナ      |
| BF | ブルキナ・ファソ     | HT | ハイチ       | MR | モロッコ     | UG | ウガンダ       |
| BI | ブルンジ         | HU | ハンガリー     | MW | マラウイ     | US | 米国         |
| BJ | ベナン          | IE | アイルランド    | MX | メキシコ     | UZ | ウズベキスタン    |
| BM | バハマ          | IL | イスラエル     | NE | ニジェール    | VN | ベトナム       |
| BN | ブラジル         | IS | アイスランド    | NL | オランダ     | YU | ユーゴスラヴィア   |
| BO | ボリビア         | IT | イタリア      | NZ | ニュージーランド | ZW | ジンバブエ      |
| CC | 中央アフリカ共和国    | KE | ケニア       | PL | ポーランド    |    |            |
| CF | コンゴ          | KR | 韓国        | PT | ポルトガル    |    |            |
| CG | コンゴ          | KP | 北朝鮮       | RO | ルーマニア    |    |            |
| CH | スイス          | KZ | カザフスタン    | RU | ロシア      |    |            |
| CI | コートジボワール     | LC | セント・ルシア   | SE | スウェーデン   |    |            |
| CM | カメルーン        | LI | リヒテンシュタイン | SG | シンガポール   |    |            |
| CN | 中国           | LK | スリランカ     | SI | スロベニア    |    |            |
| CO | コロンビア        | LS | レソト       |    |          |    |            |
| CR | クリスタリア       |    |           |    |          |    |            |
| CU | キューバ         |    |           |    |          |    |            |
| CY | キプロス         |    |           |    |          |    |            |
| CZ | チェコ          |    |           |    |          |    |            |
| DE | ドイツ          |    |           |    |          |    |            |
| DK | デンマーク        |    |           |    |          |    |            |
| EE | エストニア        |    |           |    |          |    |            |
| ES | スペイン         |    |           |    |          |    |            |