

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局



(43) 国際公開日
2004 年 4 月 15 日 (15.04.2004)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2004/031163 A1

(51) 国際特許分類⁷: C07D 277/12, B01J
31/02, 38/00, C07C 321/04, 321/08

砂町宮前町 1-8 鐘淵化学工業株式会社高砂工業
所内 Hyogo (JP).

(21) 国際出願番号: PCT/JP2003/012565

(74) 代理人: 安富 康男, 外(YASUTOMI, Yasuo et al.); 〒
532-0011 大阪府 大阪市 淀川区西中島 5 丁目 4 番
20 号 中央ビル Osaka (JP).

(22) 国際出願日: 2003 年 10 月 1 日 (01.10.2003)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB,
BG, BR, 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,
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2002-288401 2002 年 10 月 1 日 (01.10.2002) JP
特願2003-201787 2003 年 7 月 25 日 (25.07.2003) 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];
〒530-8288 大阪府 大阪市 北区中之島 3 丁目 2 番 4 号
Osaka (JP).

(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ,
SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM,
AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許
(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 特許 (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): 丸岡 啓二
(MARUOKA, Keiji) [JP/JP]; 〒606-8501 京都府 京都市
左京区北白川追分町 京都大学大学院理学研究科
化学専攻有機合成化学研究室内 Kyoto (JP). 大井 貴
史 (OOI, Takashi) [JP/JP]; 〒606-8501 京都府 京都市
左京区北白川追分町 京都大学大学院理学研究科化
学専攻有機合成化学研究室内 Kyoto (JP). 井上 健二
(INOUE, Kenji) [JP/JP]; 〒676-8688 兵庫県 高砂市 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: PROCESS FOR PRODUCING OPTICALLY ACTIVE α -SUBSTITUTED CYSTEINE OR SALT THEREOF, INTER-MEDIATE THEREFOR, AND PROCESS FOR PRODUCING THE SAME

(54) 発明の名称: 光学活性 α -置換システインまたはその塩の製造方法並びにその合成中間体及びその製造方法

(57) Abstract: A practical process for easily or industrially advantageously producing from an easily available inexpensive material an optically active α -substituted cysteine or salt thereof useful as an intermediate for medicines, etc. The process, which is for producing an optically active α -substituted cysteine or salt thereof, comprises converting a cysteine derivative into a thiazoline compound, subjecting the compound to a stereoselective substituent-introducing reaction with the aid of an optically active quaternary ammonium salt, especially an axially asymmetric quaternary ammonium salt, as a catalyst to thereby obtain an optically active thiazoline compound, and hydrolyzing it.

(57) 要約: 本発明は、医薬品等の中間体として有用な光学活性 α -置換システインまたはその塩を、安価で入手容易な原料から簡便、また工業的に有利に製造できる実用的な方法を提供する。本発明は、システイン誘導体をチアゾリン化合物とし、光学活性な 4 級アンモニウム塩、特に軸不斉 4 級アンモニウム塩を触媒として用いる立体選択的な置換基導入反応により光学活性チアゾリン化合物とし、これを加水分解することによる光学活性 α -置換システインまたはその塩の製造方法である。



WO 2004/031163 A1