

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局



(43) 国際公開日
2004 年 5 月 27 日 (27.05.2004)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2004/043973 A1

(51) 国際特許分類⁷: C07F 9/6561, 19/00, C07D 205/08,
C07F 7/18 // 7/18, C07D 477/00, 477/04

(21) 国際出願番号: PCT/JP2003/014419

(22) 国際出願日: 2003 年 11 月 13 日 (13.11.2003)

(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 2002-330127
2002 年 11 月 13 日 (13.11.2002) 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).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 西野 敬太
(NISHINO, Keita) [JP/JP]; 〒676-8688 兵庫県 高砂市
高砂町宮前町 1-8 鐘淵化学工業株式会社高砂工業
所内 Hyogo (JP). 古賀 照義 (KOGA, Teruyoshi) [JP/JP];
〒676-8688 兵庫県 高砂市 高砂町宮前町 1-8 鐘淵
化学工業株式会社高砂工業所内 Hyogo (JP).

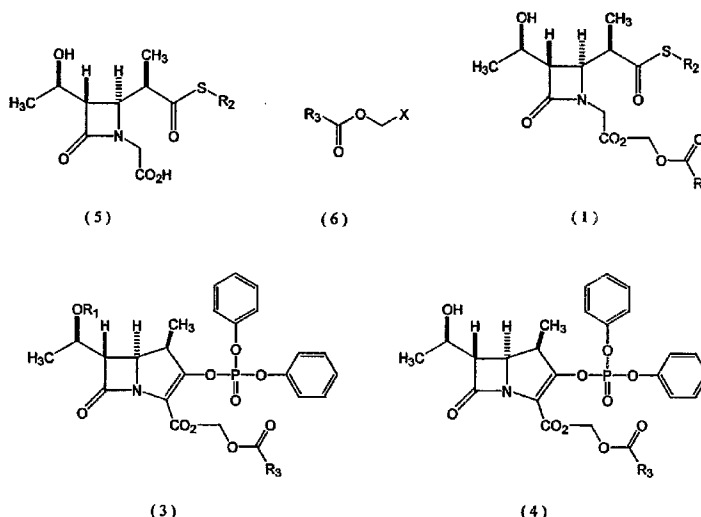
(74) 代理人: 安富 康男, 外 (YASUTOMI, Yasuo et al.); 〒
532-0011 大阪府 大阪市 淀川区西中島 5 丁目 4 番
20 号 中央ビル Osaka (JP).

(81) 指定国 (国内): 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, 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.

/ 続葉有 /

(54) Title: NOVEL INTERMEDIATE FOR CARBAPENEM COMPOUND FOR ORAL ADMINISTRATION AND PROCESS FOR PRODUCING THE SAME

(54) 発明の名称: 経口投与用カルバペネム化合物の新規合成中間体及びその製造方法



(57) Abstract: A novel intermediate which is for use in efficiently producing a 1 β -methylcarbapenem compound for oral administration; and a process for producing the intermediate. The process, which is for producing a novel β -lactam compound represented by the general formula (4), is characterized by reacting a β -lactam compound represented by the general formula (5) as a starting material with a compound represented by the general formula (6) in the presence of a base to obtain a novel β -lactam compound represented by the general formula (1), protecting the hydroxy group, subsequently cyclizing the protected compound in the presence of a strong base, reacting the cyclized compound with diphenylphosphoryl chloride to obtain a novel β -lactam compound represented by the general formula (3), and removing the protective group therefrom. (5) (6) (1) (3) (4) (In the formulae, R₁ represents trimethylsilyl or triethylsilyl; R₂ represents aryl or heteroaryl; R₃ represents C₁₋₁₀ alkyl or C₃₋₁₀ cycloalkyl; and X represents halogeno.)

/ 続葉有 /

WO 2004/043973 A1



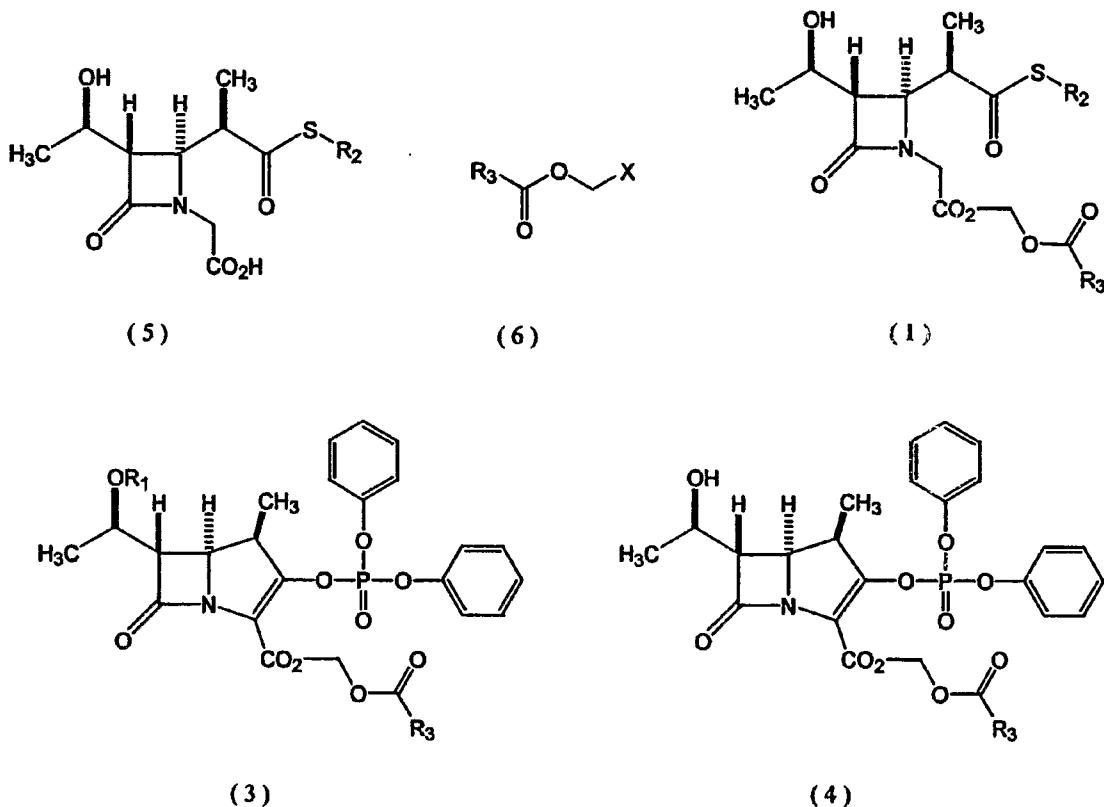
(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ

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,

[続葉有]

(57) 要約:

本発明は、経口投与用 1 β -メチルカルバペネム化合物を効率的に製造するための新規合成中間体およびその製造方法を提供する。つまり、本発明は、一般式 (5) で表される β -ラクタム化合物を出発原料とし、一般式 (6) で表される化合物と塩基の存在下に反応させ、一般式 (1) で表される新規な β -ラクタム化合物とし、水酸基を保護した後、強塩基の存在下に環化させ、さらに塩化ジフェニルリン酸と反応させることにより、一般式 (3) で表される新規な β -ラクタム化合物を得、これを脱保護することを特徴とする、一般式 (4) で表される新規な β -ラクタム化合物の製造方法である。



(式中、 R_1 : トリメチルシリル基またはトリエチルシリル基、 R_2 : アリール基またはヘテロアリール基、 R_3 : 炭素数 1 ~ 10 のアルキル基または炭素数 3 ~ 10 のシクロアルキル基、X: ハロゲン原子を示す)



TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

— 請求の範囲の補正の期限前の公開であり、補正書受領の際には再公開される。

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。