

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局(43) 国際公開日
2004 年 10 月 28 日 (28.10.2004)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2004/092113 A1(51) 国際特許分類: C07C 233/09,
233/20, 231/20, 231/08, 269/02, 271/64, 67/20, 69/533,
57/03, C12P 41/00, C12N 9/16 // C12R 1:72, 1:645, 1:38

(21) 国際出願番号: PCT/JP2004/005465

(22) 国際出願日: 2004 年 4 月 16 日 (16.04.2004)

(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2003-114783 2003 年 4 月 18 日 (18.04.2003) 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]; 〒5308288 大阪府大阪市北区中之島 3 丁目 2 番 4 号 Osaka (JP). 小野薬品工業株式会社 (ONO PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒5418526 大阪府大阪市中央区道修町 2 丁目 1 番 5 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): 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高砂工業所内 Hyogo (JP). 天野 進 (AMANO, Susumu) [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高砂工業所内 Hyogo (JP). 木崎 憲之 (KIZAKI, Noriyuki) [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高砂工業所内 Hyogo (JP). 武居 輝明 (TAKESUE, Teruaki) [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高砂工業所内 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

高砂工業所内 Hyogo (JP). 伊藤 紀幸 (ITO, Noriyuki) [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高砂工業所内 Hyogo (JP). 八十原 良彦 (YASOHARA, Yoshihiko) [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高砂工業所内 Hyogo (JP).

(74) 代理人: 安富 康男, 外 (YASUTOMI, Yasuo et al.); 〒5320011 大阪府大阪市淀川区西中島 5 丁目 4 番 2 0 号 中央ビル Osaka (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.

(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, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

- 国際調査報告書
- 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。

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 2-ALLYLCARBOXYLIC ACID DERIVATIVE AND PROCESS FOR PRODUCING THE SAME

(54) 発明の名称: 光学活性 2-アリルカルボン酸誘導体およびその製造法

(57) Abstract: A process by which an optically active 2-allylcarboxylic acid derivative which is useful as an intermediate for medicines can be easily and industrially produced from a material available at low cost; and a 2-allylcarboxamide derivative which is a novel important intermediate therefor. An N-allylcarboxamide derivative is reacted with a base by diastereoselective rearrangement to obtain a 2-allylcarboxamide derivative. This derivative is converted to a carbamate and solvolized to obtain an optically active 2-allylcarboxylic ester. This ester is stereoselectively hydrolyzed with an enzyme to produce a 2-allylcarboxylic acid having a high optical purity. The 2-allylcarboxamide derivative compound is a novel intermediate in the production process.

(57) 要約: 本発明は医薬品中間体として有用な光学活性 2-アリルカルボン酸誘導体を、安価で入手可能な原料から、簡便かつ工業的に製造可能な方法、ならびに、それらの重要新規中間体化合物 2-アリルカルボン酸アミド誘導体を提供する。カルボン酸 N-アリルアミド誘導体を塩基と反応させてジアステレオ選択的転位反応により 2-アリルカルボン酸アミド誘導体とし、次いで、カーバメート化、加溶媒分解反応により得られる光学活性 2-アリルカルボン酸エステルを、酵素を用いて立体選択的に加水分解させ、高光学純度の 2-アリルカルボン酸を製造する。また、本製造プロセスにおける新規中間体である 2-アリルカルボン酸アミド誘導体化合物である。

WO 2004/092113 A1